

B24

(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2007年11月8日 (08.11.2007)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2007/125984 A1

(51) 国際特許分類:

C07D 261/04 (2006.01) A01P 7/02 (2006.01)
A01N 43/80 (2006.01) A01P 7/04 (2006.01)
A01N 43/84 (2006.01) C07D 413/04 (2006.01)
A01N 47/02 (2006.01) C07D 413/12 (2006.01)
A01P 5/00 (2006.01)

農業株式会社 総合研究所内 Osaka (JP). 藤岡 伸祐 (FUJIOKA, Shinsuke) [JP/JP]; 〒5860094 大阪府河内長野市小山田町345 日本農業株式会社 総合研究所内 Osaka (JP). 澤田 直樹 (SAWADA, Naoki) [JP/JP]; 〒5860094 大阪府河内長野市小山田町345 日本農業株式会社 総合研究所内 Osaka (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP2007/059040

(22) 国際出願日: 2007年4月26日 (26.04.2007)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願2006-124631 2006年4月28日 (28.04.2006) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 日本農業株式会社 (NIHON NOHYAKU CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1038236 東京都中央区日本橋1丁目2番5号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 原山 博人 (HARAYAMA, Hiroto) [JP/JP]; 〒5860094 大阪府河内長野市小山田町345 日本農業株式会社 総合研究所内 Osaka (JP). 滝澤 英二 (TAKIZAWA, Eiji) [JP/JP]; 〒5860094 大阪府河内長野市小山田町345 日本農業株式会社 総合研究所内 Osaka (JP). 遠西 正範 (TOHNISHI, Masanori) [JP/JP]; 〒5860094 大阪府河内長野市小山田町345 日本農業株式会社 総合研究所内 Osaka (JP). 諏訪 明之 (SUWA, Akiyuki) [JP/JP]; 〒5860094 大阪府河内長野市小山田町345 日本

(74) 代理人: 浅村 皓, 外 (ASAMURA, Kiyoshi et al.); 〒1000004 東京都千代田区大手町2丁目2番1号 新大手町ビル331 Tokyo (JP).

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

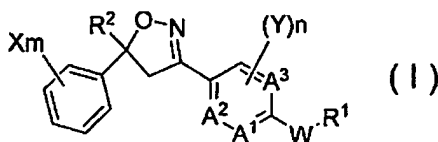
(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MT, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:
— 国際調査報告書

[続葉有]

(54) Title: ISOXAZOLINE DERIVATIVE, PEST-CONTROLLING AGENT, AND USE OF THE PEST-CONTROLLING AGENT

(54) 発明の名称: イソキサゾリン誘導体及び有害生物防除剤並びにその使用方法



active ingredient. (I) wherein R¹ represents a hydrogen atom, a halogen atom, a (C₁-C₆) alkyl group or the like; R² represents a halo(C₁-C₆) alkyl group; W represents an oxygen atom, a sulfur atom or the like; A¹, A² and A³ independently represent a nitrogen atom, C-H or C-Y; X represents a halogen atom, a cyano group, a nitro group or the like; m represents an integer ranging from 1 to 5; Y represents a halogen atom, a cyano group, a nitro group or the like; n represents an integer ranging from 0 to 4; and Z represents a halogen atom, a cyano group, a nitro group or the like.

(57) 要約: 【課題】既存薬剤に対する抵抗性害虫に有効な新規な有害生物防除剤、特に農園芸用殺虫剤であって、老齢化した就農者による省力的施用方法に適したものを提供する。【解決手段】一般式 (I) (式中、R¹は水素原子; ハロゲン原子; (C₁~C₆) アルキル基等であり; R²はハロ (C₁~C₆) アルキル基であり; Wは酸素原子; 硫黄原子等であり; A¹, A² 及び A³ は窒素原子; C-H; 又は C-Y であり; X はハロゲン原子; シアノ基; ニトロ基等であり; m は 1~5 の整数であり; Y はハロゲン原子; シアノ基; ニトロ基等であり; n は 0~4 の整数であり; Z はハロゲン原子; シアノ基; ニトロ基等である) で表されるイソキサゾリン誘導体又はその塩を有効成分とする有害生物防除剤とする。

WO 2007/125984 A1

WO 2007/125984 A1



2文字コード及び他の略語については、定期発行される
各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。

WO 2007/125984

1

PCT/JP2007/059040

明 細 書

インキサゾリン誘導体及び有害生物防除剤並びにその使用方法

技術分野

[0001] 本発明はインキサゾリン誘導体又はその塩、及び該化合物を有効成分とする有害生物防除剤、特に農園芸用殺虫剤並びにその使用方法に関する。

背景技術

[0002] 従来ある種のインキサゾリン誘導体が有害生物防除剤、特に農園芸用殺虫剤として有用であることが知られている(例えば、特許文献1～3参照。)。しかしながら、特許文献1及び2に記載の化合物はインキサゾリン環の3位(ヘテロ)アリール基の4位にアミド又はチオアミドが結合した化合物であり、特許文献3に記載の化合物はインキサゾリン環の3位(ヘテロ)アリール基の4位にヘテロ環が結合した化合物であり、インキサゾリン環の3位(ヘテロ)アリール基の4位に酸素原子、硫黄原子、窒素原子等のアミド又はチオアミド以外の官能基が結合した本発明化合物とは異なる。また、本発明化合物が有害生物防除剤、特に農園芸用殺虫剤として有用であることは知られていない。

特許文献1:国際公開第05/085216号パンフレット

特許文献2:国際公開第07/026965号パンフレット

特許文献3:特開2007-016017号公報

発明の開示

発明が解決しようとする課題

[0003] 農業及び園芸等の作物生産において、害虫等による被害は今なお大きく、既存薬剤に対する抵抗性害虫の発生等の要因から新規な有害生物防除剤、特に農園芸用殺虫剤の開発が望まれている。又、就農者の高齢化等により各種の省力的施用方法が求められるとともに、これらの施用方法に適した性格を有する有害生物防除剤、特に農園芸用殺虫剤の創出が求められている。

課題を解決するための手段

[0004] 本発明者等は新規な有害生物防除剤、特に農園芸用殺虫剤を開発すべく鋭意研

WO 2007/125984

2

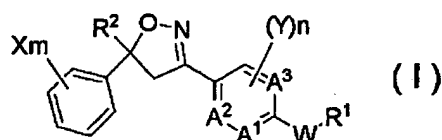
PCT/JP2007/059040

究を重ねた結果、本発明の一般式(I)で表されるイソキサゾリン誘導体が、文献未記載の新規化合物であり、有害生物防除剤、特に農園芸用殺虫剤として優れた防除効果を示すことを見だし、本発明を完成させたものである。

[0005] 即ち本発明は、

(1) 一般式(I)

[化1]



(式中、 R^1 は水素原子;ハロゲン原子; $(C_1 \sim C_6)$ アルキル基; Z により置換された置換($C_1 \sim C_6$)アルキル基; $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル基; Z により置換された置換($C_3 \sim C_7$)シクロアルキル基; $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル基; Z により置換された置換($C_2 \sim C_6$)アルケニル基; $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル基; Z により置換された置換($C_2 \sim C_6$)アルキニル基;フェニル基; Z により置換された置換フェニル基;複素環基; Z により置換された置換複素環基;モノ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノ基; Z により置換された置換モノ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノ基;同一又は異なっても良いジ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノ基; Z により置換された同一又は異なっても良い置換ジ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノ基;フェニルアミノ基; Z により置換された置換フェニルアミノ基;複素環アミノ基; Z により置換された置換複素環アミノ基;ホルミル基; $(C_1 \sim C_6)$ アルキルカルボニル基; Z により置換された置換($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル基; $(C_1 \sim C_6)$ シクロアルキルカルボニル基; Z により置換された置換($C_1 \sim C_6$)シクロアルキルカルボニル基; $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル基; Z により置換された置換($C_1 \sim C_6$)アルコキシカルボニル基; $(C_1 \sim C_6)$ アルキルチオカルボニル基; Z により置換された置換($C_1 \sim C_6$)アルキルチオカルボニル基;ベンゾイル基; Z により置換された置換ベンゾイル基;複素環カルボニル基; Z により置換された置換複素環カルボニル基;モノ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノカルボニル基; Z により置換された置換モノ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノカルボニル基;同一又は異なっても良いジ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノカルボニル基; Z により置換された同一又は異なつ

WO 2007/125984

3

PCT/JP2007/059040

でも良い置換ジ(C₁~C₆)アルキルアミノカルボニル基;フェニルアミノカルボニル基;Zにより置換された置換フェニルアミノカルボニル基;複素環アミノカルボニル基;Zにより置換された置換複素環アミノカルボニル基;(C₁~C₆)アルキルスルホニル基;Zにより置換された置換(C₁~C₆)アルキルスルホニル基;フェニルスルホニル基;Zにより置換された置換フェニルスルホニル基;モノ(C₁~C₆)アルキルアミノスルホニル基;Zにより置換された置換モノ(C₁~C₆)アルキルアミノスルホニル基;同一又は異なっても良いジ(C₁~C₆)アルキルアミノスルホニル基;Zにより置換された同一又は異なっても良い置換ジ(C₁~C₆)アルキルアミノスルホニル基;フェニルアミノスルホニル基;又はZにより置換された置換フェニルアミノスルホニル基を示す。

[0006] R²はハロ(C₁~C₆)アルキル基を示す。

Wは酸素原子;硫黄原子;-SO-;-SO₂-;-N(R³)-(式中、R³は水素原子;(C₁~C₆)アルキル基;Zにより置換された(C₁~C₆)アルキル基;(C₁~C₆)シクロアルキル基;Zにより置換された(C₁~C₆)シクロアルキル基;シアノ基;ホルミル基;チオホルミル基;(C₁~C₆)アルキルカルボニル基;Zにより置換された置換(C₁~C₆)アルキルカルボニル基;(C₁~C₆)アルコキシカルボニル基;Zにより置換された置換(C₁~C₆)アルコキシカルボニル基;(C₁~C₆)アルキルチオカルボニル基;Zにより置換された置換(C₁~C₆)アルキルチオカルボニル基;ベンゾイル基;Zにより置換された置換ベンゾイル基;複素環カルボニル基;Zにより置換された置換複素環カルボニル基;モノ(C₁~C₆)アルキルアミノカルボニル基;Zにより置換された置換モノ(C₁~C₆)アルキルアミノカルボニル基;モノ(C₁~C₆)アルキルアミノチオカルボニル基;Zにより置換された置換モノ(C₁~C₆)アルキルアミノチオカルボニル基;同一又は異なっても良いジ(C₁~C₆)アルキルアミノカルボニル基;Zにより置換された同一又は異なっても良い置換ジ(C₁~C₆)アルキルアミノカルボニル基;フェニルアミノカルボニル基;Zにより置換された置換フェニルアミノカルボニル基;複素環アミノカルボニル基;Zにより置換された置換複素環アミノカルボニル基;(C₁~C₆)アルキルスルホニル基;Zにより置換された置換(C₁~C₆)アルキルスルホニル基;フェニルスルホニル基;Zにより置換された置換フェニルスルホニル基;モノ(C₁~C₆)アルキルアミノスルホニル基;Zにより置換された置換モノ(C₁~C₆)アルキルアミノスルホニル基;同一又は異なっても

WO 2007/125984

4

PCT/JP2007/059040

も良いジ(C₁~C₆)アルキルアミノスルホニル基;Zにより置換された同一又は異なっても良い置換ジ(C₁~C₆)アルキルアミノスルホニル基;フェニルアミノスルホニル基;又はZにより置換された置換フェニルアミノスルホニル基を示す。又、R³はR¹と一緒になって=C(R⁷)NR⁸R⁹(式中、R⁷、R⁸及びR⁹は同一又は異なっても良く、水素原子;(C₁~C₆)アルキル基;Zにより置換された(C₁~C₆)アルキル基;(C₁~C₆)アルケニル基;Zにより置換された(C₁~C₆)アルケニル基;(C₁~C₆)アルキニル基;Zにより置換された(C₁~C₆)アルキニル基;(C₁~C₆)アルコキシ基;Zにより置換された(C₁~C₆)アルコキシ基;フェニル基;Zにより置換された置換フェニル基;複素環基;又はZにより置換された置換複素環基を示す。又、R⁸とR⁹は結合して、ピロリジン環、ピペリジン環、ピペラジン環、モリホリン環、チオモルホリン環及び4-オキソチオモルホリン環から選択される複素環を形成することができ、該複素環はZにより置換されていても良い。)又は=C(SR¹⁰)₂(式中、R¹⁰は(C₁~C₆)アルキル基又はZにより置換された置換(C₁~C₆)アルキル基を示す。)で表される基を示すことができる。)を示す。);又は-C(R⁴)(R⁵)-(式中、R⁴及びR⁵は同一又は異なっても良く、水素原子又はハロゲン原子を示す。)を示す。

[0007] A¹、A²及びA³は同一又は異なっても良く、窒素原子;C-H;又はC-Yを示す。

Xはハロゲン原子;シアノ基;ニトロ基;(C₁~C₆)アルキル基;ハロ(C₁~C₆)アルキル基;(C₃~C₇)シクロアルキル基;ハロ(C₃~C₇)シクロアルキル基;(C₁~C₆)アルコキシ基;ハロ(C₁~C₆)アルコキシ基;(C₃~C₇)シクロアルコキシ基;ハロ(C₃~C₇)シクロアルコキシ基;(C₁~C₆)アルキルチオ基;ハロ(C₁~C₆)アルキルチオ基;(C₃~C₇)シクロアルキルチオ基;ハロ(C₃~C₇)シクロアルキルチオ基;(C₁~C₆)アルキルスルフィニル基;ハロ(C₁~C₆)アルキルスルフィニル基;(C₃~C₇)シクロアルキルスルフィニル基;ハロ(C₃~C₇)シクロアルキルスルフィニル基;(C₁~C₆)アルキルスルホニル基;ハロ(C₁~C₆)アルキルスルホニル基;(C₃~C₇)シクロアルキルスルホニル基;ハロ(C₃~C₇)シクロアルキルスルホニル基;フェニル基;Zにより置換された置換フェニル基;複素環基;又はZにより置換された置換複素環基を示し、mは1~5の整数を示す。

[0008] Yはハロゲン原子;シアノ基;ニトロ基;(C₁~C₆)アルキル基;Zにより置換された(C₁

$\sim C_6$)アルキル基; $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル基; Zにより置換された $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル基; $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ基; Zにより置換された $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ基; $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルコキシ基; Zにより置換された $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルコキシ基; $(C_1 \sim C_6)$ アルキルチオ基; Zにより置換された $(C_1 \sim C_6)$ アルキルチオ基; $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルチオ基; Zにより置換された $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルチオ基; $(C_1 \sim C_6)$ アルキルスルフィニル基; Zにより置換された $(C_1 \sim C_6)$ アルキルスルフィニル基; $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルスルフィニル基; Zにより置換された $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルスルフィニル基; $(C_1 \sim C_6)$ アルキルスルホニル基; Zにより置換された $(C_1 \sim C_6)$ アルキルスルホニル基; $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルスルホニル基; Zにより置換された $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルスルホニル基; フェニル基; Zにより置換された置換フェニル基; 複素環基; Zにより置換された置換複素環基; フェノキシ基; Zにより置換された置換フェノキシ基; 複素環オキシ基; Zにより置換された置換複素環オキシ基; $(C_1 \sim C_6)$ アルキルカルボニル基; Zにより置換された置換 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルカルボニル基; $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル基; Zにより置換された置換 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル基; $(C_1 \sim C_6)$ アルキルチオカルボニル基; Zにより置換された置換 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルチオカルボニル基; ベンゾイル基; Zにより置換された置換ベンゾイル基; 複素環カルボニル基; Zにより置換された置換複素環カルボニル基; モノ $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミノカルボニル基; Zにより置換された置換モノ $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミノカルボニル基; 同一又は異なっても良いジ $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミノカルボニル基; Zにより置換された同一又は異なっても良い置換ジ $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミノカルボニル基; フェニルアミノカルボニル基; Zにより置換された置換フェニルアミノカルボニル基; 複素環アミノカルボニル基; Zにより置換された置換複素環アミノカルボニル基; $(C_1 \sim C_6)$ アルキルスルホニル基; Zにより置換された置換 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルスルホニル基; フェニルスルホニル基; Zにより置換された置換フェニルスルホニル基; モノ $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミノスルホニル基; Zにより置換された置換モノ $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミノスルホニル基; 同一又は異なっても良いジ $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミノスルホニル基; Zにより置換された同一又は異なっても良い置換ジ $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミノスルホニル基; フェニルアミノスルホニル基; Zにより置換された置換フェニルアミノスルホニル基; モノ $(C_1 \sim C_6)$

WO 2007/125984

6

PCT/JP2007/059040

アルキルアミノ基;Zにより置換された置換モノ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノ基;同一又は異なっても良いジ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノ基;Zにより置換された同一又は異なっても良い置換ジ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノ基;フェニルアミノ基;Zにより置換された置換フェニルアミノ基、複素環アミノ基;Zにより置換された置換複素環アミノ基;モノ($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニルアミノ基;Zにより置換された置換モノ($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニルアミノ基;同一又は異なっても良いジ($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニルアミノ基;Zにより置換された同一又は異なっても良い置換ジ($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニルアミノ基;フェニルカルボニルアミノ基;Zにより置換された置換フェニルカルボニルアミノ基;複素環カルボニルアミノ基;Zにより置換された置換複素環カルボニルアミノ基;モノ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニルアミノ基;Zにより置換された置換モノ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニルアミノ基;同一又は異なっても良いジ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニルアミノ基;Zにより置換された同一又は異なっても良い置換ジ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニルアミノ基;フェニルスルホニルアミノ基;Zにより置換された置換フェニルスルホニルアミノ基;複素環スルホニルアミノ基;又はZにより置換された置換複素環スルホニルアミノ基を示し、nは0～4の整数を示す。

[0009] Zは同一又は異なっても良く、ハロゲン原子;シアノ基;ニトロ基;($C_1 \sim C_6$)アルキル基;ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル基;シクロ($C_3 \sim C_7$)アルキル基;ハロシクロ($C_3 \sim C_7$)アルキル基;($C_1 \sim C_6$)アルコキシ基;ハロ($C_1 \sim C_6$)アルコキシ基;($C_1 \sim C_6$)アルキルチオ基;ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルチオ基;($C_1 \sim C_6$)アルキルスルフィニル基;ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルフィニル基;($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル基;ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル基;($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル基;ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル基;モノ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノ基;同一又は異なっても良いジ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノ基;フェニル基;同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、($C_1 \sim C_6$)アルキル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルキル基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルキル基、($C_1 \sim C_6$)アルコキシ基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルコキシ基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルコキシ基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルコキシ基、($C_1 \sim C_6$)アルキルチオ基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルチオ基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルチオ基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルチオ基、($C_1 \sim C_6$)アルキルスルフィニル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)

WO 2007/125984

7

PCT/JP2007/059040

)アルキルスルフィニル基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルスルフィニル基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルスルフィニル基、($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルスルホニル基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルスルホニル基、($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル基、($C_1 \sim C_6$)アルコキシカルボニル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルコキシカルボニル基、フェニル基及び複素環基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基;複素環基;同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、($C_1 \sim C_6$)アルキル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルキル基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルキル基、($C_1 \sim C_6$)アルコキシ基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルコキシ基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルコキシ基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルコキシ基、($C_1 \sim C_6$)アルキルチオ基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルチオ基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルチオ基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルチオ基、($C_1 \sim C_6$)アルキルスルフィニル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルフィニル基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルスルフィニル基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルスルフィニル基、($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルスルホニル基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルスルホニル基、($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル基、($C_1 \sim C_6$)アルコキシカルボニル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルコキシカルボニル基、フェニル基及び複素環基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基;

[0010] フェノキシ基;同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、($C_1 \sim C_6$)アルキル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルキル基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルキル基、($C_1 \sim C_6$)アルコキシ基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルコキシ基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルコキシ基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルコキシ基、($C_1 \sim C_6$)アルキルチオ基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルチオ基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルチオ基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルチオ基、($C_1 \sim C_6$)アルキルスルフィニル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルフィニル基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルスルフィニル基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルスルフィニル基、($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルスルホニル基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルスルホニル基、($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル基、(

[0011] フェニルチオ基;同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、($C_1 \sim C_6$)アルキル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルキル基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルキル基、($C_1 \sim C_6$)アルコキシ基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルコキシ基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルコキシ基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルコキシ基、($C_1 \sim C_6$)アルキルチオ基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルチオ基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルチオ基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルチオ基、($C_1 \sim C_6$)アルキルスルフィニル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルフィニル基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルスルフィニル基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルスルフィニル基、($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルスルホニル基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルスルホニル基、($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル基、($C_1 \sim C_6$)アルコキシカルボニル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルコキシカルボニル基、フェニル基及び複素環基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルチオ基;複素環チオ基;同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、($C_1 \sim C_6$)アルキル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルキル基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルキル基、

WO 2007/125984

9

PCT/JP2007/059040

C_7)シクロアルキル基、($C_1 \sim C_6$)アルコキシ基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルコキシ基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルコキシ基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルコキシ基、($C_1 \sim C_6$)アルキルチオ基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルチオ基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルチオ基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルチオ基、($C_1 \sim C_6$)アルキルスルフィニル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルフィニル基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルスルフィニル基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルスルフィニル基、($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルスルホニル基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルスルホニル基、($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル基、($C_1 \sim C_6$)アルコキシカルボニル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルコキシカルボニル基、フェニル基及び複素環基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環チオ基；モノ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノ基；同一又は異なっても良いジ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノ基；

[0012] フェニルアミノ基；同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、($C_1 \sim C_6$)アルキル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルキル基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルキル基、($C_1 \sim C_6$)アルコキシ基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルコキシ基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルコキシ基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルコキシ基、($C_1 \sim C_6$)アルキルチオ基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルチオ基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルチオ基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルチオ基、($C_1 \sim C_6$)アルキルスルフィニル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルフィニル基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルスルフィニル基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルスルフィニル基、($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルスルホニル基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルスルホニル基、($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル基、($C_1 \sim C_6$)アルコキシカルボニル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルコキシカルボニル基、フェニル基及び複素環基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルアミノ基；複素環アミノ基；同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、($C_1 \sim C_6$)アルキル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルキル基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルキル基、($C_1 \sim C_6$)アルコキシ基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルコキシ基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルコキシ基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルコキシ基、($C_1 \sim C_6$)アル

WO 2007/125984

10

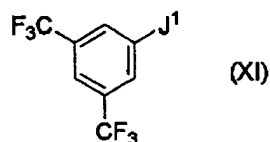
PCT/JP2007/059040

キルチオ基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルチオ基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルチオ基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルチオ基、($C_1 \sim C_6$)アルキルスルフィニル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルフィニル基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルスルフィニル基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルスルフィニル基、($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルスルホニル基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルスルホニル基、($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル基、($C_1 \sim C_6$)アルコキシカルボニル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルコキシカルボニル基、フェニル基及び複素環基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換複素環アミノ基、($C_1 \sim C_6$)アルコキシカルボニル基;又はハロ($C_1 \sim C_6$)アルコキシカルボニル基から選択される1~5個の置換基を示す。)で表されるイソキサゾリン誘導体又はその塩、

- [0013] (2) Wが酸素原子、硫黄原子、 $-SO-$ 、又は $-SO_2-$ である(1)に記載のイソキサゾリン誘導体又はその塩、
- (3) Wが $-N(R^3)-$ (式中、 R^3 は(1)に同じ。)である(1)に記載のイソキサゾリン誘導体又はその塩、
- (4) Wが $-C(R^4)(R^5)-$ (式中、 R^5 及び R^6 は(1)に同じ。)である(1)に記載のイソキサゾリン誘導体又はその塩、
- (5) R^2 がフルオロ($C_1 \sim C_6$)アルキル基である(1)乃至(4)いずれか1つに記載のイソキサゾリン誘導体又はその塩、
- (6) R^2 がトリフルオロメチル基である(1)乃至(4)いずれか1つに記載のイソキサゾリン誘導体又はその塩、
- (7) Xがハロゲン原子又はハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル基である(1)乃至(6)いずれか1つに記載のイソキサゾリン誘導体又はその塩、
- (8) (1)乃至(7)いずれか1つに記載のイソキサゾリン誘導体又はその塩を有効成分とする有害生物防除剤、
- (9) 有害生物防除剤が農園芸用殺虫剤である(8)に記載の有害生物防除剤、
- (10) 有用植物から有害生物を防除するために、(8)又は(9)に記載の殺虫剤の有効量を対象植物又は土壌に処理することを特徴とする殺虫剤の使用方法及び、

(11)一般式(XI)

[化2]



(式中、 J^1 は塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、 $(C_1 \sim C_4)$ アルキルスルホニルオキシ基、ハロ $(C_1 \sim C_4)$ アルキルスルホニルオキシ基、 $-B(OH)_2$ 基、 $-B(OMe)_2$ 基、 $-B(OEt)_2$ 基、4, 4, 5, 5-テトラメチル-1, 3, 2-ジオキサボラン-2-イル基、 $-Si(OEt)_3$ 基、 $-ZnCl$ 基、 $-ZnBr$ 基、 $-ZnI$ 基、 $-MgCl$ 基、 $-MgBr$ 基又は $-MgI$ 基を示す。)で表される3, 5-ビス(トリフルオロメチル)ベンゼン誘導体と

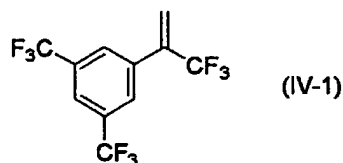
一般式(XII)

[化3]



(式中、 J^2 は塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、 $-B(OH)_2$ 基、 $-B(OMe)_2$ 基、 $-B(OEt)_2$ 基を示す。)で表されるオレフィン類とを、パラジウム、ニッケル等の遷移金属触媒の存在下、クロスカップリングさせることを特徴とする式(IV-1)

[化4]



で表される3, 5-ビス(トリフルオロメチル)-1-(1-トリフルオロメチルエテニル)ベンゼンの製造方法に関する。

発明の効果

[0014] 本発明によれば、従来技術に比べて優れた性能を有する有害生物防除剤、特に

WO 2007/125984

12

PCT/JP2007/059040

農園芸用殺虫剤を提供できる。

発明を実施するための最良の形態

[0015] 本発明のインキサゾリン誘導体誘導体の一般式(I)の定義において、各置換基における「ハロ」、「 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル」、「 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ」、「 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル」、「 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル」又は「複素環」等は以下の意味を示す。

「ハロ」又は「ハロゲン原子」とは、塩素原子、臭素原子、ヨ素原子又はフッ素原子を示す。「 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル」とは、直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1～6個のアルキルを示し、例えば、メチル、エチル、*n*-プロピル、*i*-プロピル、*n*-ブチル、*i*-ブチル、*s*-ブチル、*t*-ブチル、*n*-ペンチル、*n*-ヘキシル等が挙げられる。「 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル」とは、環状の炭素原子数3～7個のアルキルを示し、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル等が挙げられる。「 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ」とは、そのアルキル部位が上記「 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル」であるアルコキシを示し、例えば、メキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、イソブトキシ、*t*-ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ等が挙げられる。「 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル」とは、少なくとも1個の二重結合を有する直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数2～6個のアルケニルを示し、例えば、ビニル、1-プロペニル、アリル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、2-ペンテニル、2, 4-ペンタジエニル、3-ヘキセニル等が挙げられる。「 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル」とは、少なくとも1個の三重結合を有する直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数2～6個のアルキニルを示し、例えば、エチニル、2-プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニル、3-ブチニル、2-ペンチニル、3-ヘキシニル等が挙げられる。又、「 $C_2 \sim C_6$ 」、「 $C_3 \sim C_7$ 」等の数字は炭素原子2個～6個、3個～10個のように炭素原子数の範囲を示す。更に、上記置換基が連結した基についても上記定義を示すことができ、例えば、「ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル」の場合は、同一又は異なっても良い1以上のハロゲン原子により置換された直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1～6個のアルキル基を示し、例えば、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、パーフルオロヘキシル等が挙げられる。

[0016] 「複素環」とは、酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選択される1以上のヘテロ原子を有する5又は6員複素環を示し、例えば、ピリジン、ピリジン-N-オキシド、ピ

リミジン、ピラジン、ピリダジン、トリアジン、フラン、テトラヒドロフラン、チオフェン、テトラヒドロチオフェン、ピロール、ピロリジン、ピラン、テトラヒドロピラン、チオピラン、テトラヒドロチオピラン、オキサゾール、オキサゾリン、イソオキサゾール、イソキサゾリン、オキサジアゾール、オキサジアゾリン、チアゾール、チアゾリン、イソチアゾール、イソチアゾリン、チアジアゾール、チアジアゾリン、イミダゾール、イミダゾリン、トリアゾール、トリアゾリン、ピラゾール、ピラゾリン等が挙げられる。

[0017] 本発明の一般式(I)で表されるイソキサゾリン誘導体において、Wが酸素原子、硫黄原子、 $-\text{SO}-$ 、又は $-\text{SO}_2-$ である場合、 R^1 として好ましくは $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキル基、Zにより置換された置換 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキル基、 $(\text{C}_3 \sim \text{C}_7)$ シクロアルキル基、Zにより置換された置換 $(\text{C}_3 \sim \text{C}_7)$ シクロアルキル基、 $(\text{C}_2 \sim \text{C}_6)$ アルケニル基、Zにより置換された置換 $(\text{C}_2 \sim \text{C}_6)$ アルケニル基、 $(\text{C}_2 \sim \text{C}_6)$ アルキニル基、Zにより置換された置換 $(\text{C}_2 \sim \text{C}_6)$ アルキニル基、フェニル基、Zにより置換された置換フェニル基、複素環基又はZにより置換された置換複素環基である。Wが $-\text{N}(\text{R}^3)-$ (R^3 は前記に同じ。)である場合、 R^1 として好ましくは $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキルカルボニル基、Zにより置換された置換 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキルカルボニル基、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルコキシカルボニル基、Zにより置換された置換 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルコキシカルボニル基、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキルチオカルボニル基、Zにより置換された置換 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキルチオカルボニル基、ベンゾイル基、Zにより置換された置換ベンゾイル基、複素環カルボニル基、Zにより置換された置換複素環カルボニル基、モノ $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキルアミノカルボニル基、Zにより置換された置換モノ $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキルアミノカルボニル基、同一又は異なっても良いジ $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキルアミノカルボニル基、Zにより置換された同一又は異なっても良い置換ジ $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキルアミノカルボニル基、フェニルアミノカルボニル基、Zにより置換された置換フェニルアミノカルボニル基、複素環アミノカルボニル基、Zにより置換された置換複素環アミノカルボニル基、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキルスルホニル基、Zにより置換された置換 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキルスルホニル基、フェニルスルホニル基、Zにより置換された置換フェニルスルホニル基、モノ $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキルアミノスルホニル基、Zにより置換された置換モノ $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキルアミノスルホニル基、同一又は異なっても良いジ $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキルアミノスルホニル基、Zにより置換された同一又は異なつ

WO 2007/125984

14

PCT/JP2007/059040

でも良い置換ジ(C₁~C₆)アルキルアミノスルホニル基、フェニルアミノスルホニル基又はZにより置換された置換フェニルアミノスルホニル基である。Wが-C(R⁴)(R⁵)-(R⁴及びR⁵は前記に同じ。)である場合、R¹として好ましくはハロゲン原子、(C₁~C₆)アルキル基又はZにより置換された置換(C₁~C₆)アルキル基である。R²として好ましくはフルオロC₁~C₆アルキル基であり、特に好ましくはトリフルオロメチル基である。A¹、A²及びA³として好ましくは窒素原子、C-H又はC-Yである。Xとして好ましくはハロゲン原子又はハロ(C₁~C₆)アルキル基であり、mとして好ましくは1~3の整数であり、特に好ましくは2又は3である。

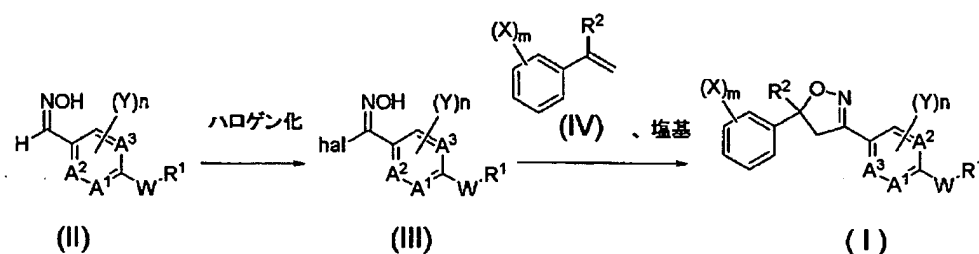
[0018] Yとして好ましくはハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C₁~C₆)アルキル基、Zにより置換された(C₁~C₆)アルキル基、(C₁~C₆)アルコキシ基、Zにより置換された(C₁~C₆)アルコキシ基、(C₁~C₆)アルキルスルホニル基、Zにより置換された(C₁~C₆)アルキルスルホニル基、(C₁~C₆)アルキルカルボニル基、Zにより置換された置換(C₁~C₆)アルキルカルボニル基、モノ(C₁~C₆)アルキルカルボニルアミノ基、Zにより置換された置換モノ(C₁~C₆)アルキルカルボニルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(C₁~C₆)アルキルカルボニルアミノ基、Zにより置換された同一又は異なっても良い置換ジ(C₁~C₆)アルキルカルボニルアミノ基、フェニルカルボニルアミノ基;Zにより置換された置換フェニルカルボニルアミノ基、複素環カルボニルアミノ基、Zにより置換された置換複素環カルボニルアミノ基、モノ(C₁~C₆)アルキルスルホニルアミノ基;Zにより置換された置換モノ(C₁~C₆)アルキルスルホニルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(C₁~C₆)アルキルスルホニルアミノ基、Zにより置換された同一又は異なっても良い置換ジ(C₁~C₆)アルキルスルホニルアミノ基、フェニルスルホニルアミノ基又はZにより置換された置換フェニルスルホニルアミノ基であり、nとして好ましくは0~2の整数である。

[0019] 本発明の一般式(I)で表されるイソキサゾリン誘導体の塩としては、例えば塩酸塩、硫酸塩、硝酸塩、リン酸塩等の無機酸塩、酢酸塩、フマル酸塩、マレイン酸塩、シュウ酸塩、メタンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、パラトルエンスルホン酸塩等の有機酸塩、ナトリウムイオン、カリウムイオン、カルシウムイオン、トリメチルアンモニウム等の無機又は有機の塩基との塩を例示することができる。

[0020] 本発明の一般式(I)で表されるインキサゾリン誘導体は、国際公開第05/085216号パンフレットに記載の方法に準じて製造することができ、例えば下記に図示する製造方法により製造することができるが、これらに限定されるものではない。

製造方法1.

[化5]



(式中、 R^1 、 R^2 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 X 、 Y 、 W 、 m 、及び n は前記に同じくし、 hal はハロゲン原子を示す。)

[0021] 即ち、一般式(II)で表されるアルドキシム類を不活性溶媒及び塩基の存在下又は不存在下、ハロゲン化剤を用いてハロゲン化することにより一般式(III)で表されるヒドロキサム酸ハライド類とし、該ヒドロキサム酸ハライド類と一般式(IV)で表されるオレフィン類とを不活性溶媒中で塩基の存在下又は不存在下に反応させることにより、本発明の一般式(I)で表されるインキサゾリン誘導体を製造することができる。

[0022] [1-1] 一般式(II) → 一般式(III)

本反応で利用できる不活性溶媒としては、反応を著しく阻害しないものであれば特に限定されず、例えば水；メタノール、エタノール等のアルコール類；ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素；アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン等のケトン類；クロロホルム、ジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類；酢酸エチル、酢酸メチル等のエステル類；テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、メチルtertブチルエーテル、1,2-ジメトキシエタン、1,4-ジオキサン等の鎖状又は環状エーテル類；アセトニトリル等のニトリル類；N,N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ジメチルスルホキシド等の極性溶媒等を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

WO 2007/125984

16

PCT/JP2007/059040

[0023] 本反応で使用できる塩基としては、例えば水素化ナトリウム等のアルカリ金属水素化物;水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物;炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩;無機塩類;ピリジン、DBU(1, 8-ジアザビシクロ[5. 4. 0]ウンデック-7-エン)、トリエチルアミン等の有機塩基等を挙げることができ、その使用量は一般に式(II)で表されるアルドキシム類に対して等モルから過剰モルの範囲で適宜選択して反応を行えばよい。

[0024] 本反応で使用できるハロゲン化剤としては例えばN-クロロコハク酸イミド、N-ブromoコハク酸イミド等のN-ハロコハク酸イミド類;次亜塩素酸ナトリウム等の次亜ハロゲンアルカリ金属塩類;次亜塩素酸-t-ブチルエステル等の次亜ハロゲン酸エステル類;塩素ガス等の単体ハロゲン類;塩化スルフリル等を挙げることができ、その使用量は一般に式(II)で表されるアルドキシム類に対して等モルから過剰モルの範囲で適宜選択して反応を行えばよい。

[0025] 反応温度は-50℃～使用する不活性溶媒の沸点域の範囲で適宜行えばよく、好ましくは室温～80℃である。反応時間は反応の規模及び反応温度によって一定しないが、数分～48時間の範囲である。反応終了後、一般式(III)で表されるヒドロキサム酸ハライド類が安定な場合は目的物を含む反応系から常法に従って単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができるが、単離せずにそのまま次の反応に使用することもできる。一般式(III)で表されるヒドロキサム酸ハライド類が不安定な場合は反応液を精製せずにそのまま次の反応に使用すれば良い。

[0026] [1-2] 一般式(III)→ 一般式(I)

本反応は国際公開第05/085216号パンフレットに記載の方法に従って目的物を製造することができる。

本反応で使用できる不活性溶媒としては、反応を著しく阻害しないものであれば特に限定されず、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素;クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類;アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン等のケトン類;クロロホルム、ジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類;酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類;テトラヒドロフ

ラン、ジエチルエーテル、メチルtert-ブチルエーテル、1, 2-ジメトキシエタン、1, 4-ジオキサン等の鎖状又は環状エーテル類;アセトニトリル等のニトリル類;N, N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ジメチルスルホキシド等の極性溶媒等を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

[0027] 本反応で利用できる塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物;炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩;炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等のアルカリ金属重炭酸塩;ピリジン、N, N-ジメチルアニリン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン、DBU(1, 8-ジアザビシクロ[5. 4. 0]ウンデック-7-エン)、トリエチルアミン、トリブチルアミン等の有機塩基等を挙げることができ、その使用量は一般式(III)で表されるヒドロキサム酸ハライド類に対して等モルから過剰モルの範囲で適宜選択して反応を行えばよい。

[0028] 反応温度は-50℃～使用する不活性溶媒の沸点域の範囲で適宜行えばよく、好ましくは室温～80℃である。反応時間は反応の規模及び反応温度によって一定しないが、数分～100時間の範囲である。本反応は等モル反応であるので一般式(III)で表されるヒドロキサム酸ハライド類及び一般式(IV)で表されるオレフィン類を等モル使用すれば良いが、いずれかの反応剤を過剰に用いても良い。

[0029] 反応終了後、本発明の一般式(I)で表されるイソキサゾリン誘導体を単離するには、水に溶解する溶媒を用いた場合は、減圧下溶媒を留去し、水を加えた後、水に不溶のベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素系溶媒;クロロホルム、ジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒;酢酸エチル等のエステル系溶媒で抽出し、飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウム、無水硫酸マグネシウム等の乾燥剤で乾燥し、減圧下で溶媒を留去すれば良い。水に不溶の溶媒を用いた場合は、反応混合物に水を加えた後分液し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウム、無水硫酸マグネシウム等の乾燥剤で乾燥し、減圧下で溶媒を留去すれば良い。溶媒留去後得られた残渣を、再結晶、懸濁洗浄、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより、本発明の一般式(I)で表されるイソキサゾリン誘導体を製造することができる。

WO 2007/125984

18

PCT/JP2007/059040

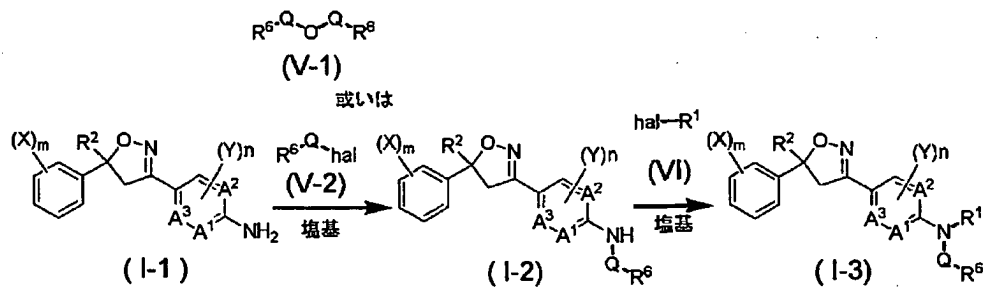
[0030] 一般的には、例えば一般式(II)で表されるアルドキシム類1当量に対して1～2当量のN-クロロコハク酸イミド、次亜塩素酸ナトリウム水溶液、次亜塩素酸-t-ブチルエステル、塩素ガス等のハロゲン化剤を用い、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、1, 4-ジオキサン、N, N-ジメチルホルムアミド等の溶媒を用い、0℃からこれらの沸点温度の範囲で、10分から2時間反応を行なうことで一般式(III)で表されるヒドロキサム酸ハライド類を得ることができる。次いで、一般式(III)で表されるヒドロキサム酸ハライド類を単離することなく、1～2当量の一般式(IV)で表されるオレフィン類及び1～2当量の炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、トリエチルアミン等の塩基を添加し、0℃～溶媒の沸点付近の温度の範囲で、10分～24時間反応を行なうのが好ましい。

[0031] 本発明の原料化合物である一般式(III)で表されるヒドロキサム酸ハライド類及び一般式(IV)で表されるオレフィン誘導体は国際公開第05/085216号パンフレットに記載の方法に従って製造することができる。

[0032] 製造方法2.

本発明の一般式(I)で表されるイソキサゾリン誘導体のうち、Wが-N(R³)- (式中、R³は前記に同じ。)で示される化合物(I-2)及び(I-3)は、例えば下記に図示する製造方法により製造することができるが、これに限定されるものではない。

[化6]



(式中、R¹、R²、A¹、A²、A³、X、Y、m、n及びhalは前記に同じくし、Qはカルボニル基又はスルホニル基を示し、R⁶は(C₁～C₆)アルキル基、ハロ(C₁～C₆)アルキル基、(C₁～C₆)アルコキシ基、ハロ(C₁～C₆)アルコキシ基、フェニル基又は置換フェニル基を示す。)

[0033] 一般式(I-1)で表されるアミン誘導体と一般式(V-1)又は(V-2)で表される酸無水物若しくは酸ハロゲン化物又はスルホン酸無水物若しくはスルホン酸ハロゲン化物とを塩基の存在下、不活性溶媒の存在下又は不存在下に反応させ、一般式(I-2)で表されるアミド誘導体を製造することができる。更に、該アミド誘導体と一般式(VI)で表されるハロゲン化物とを塩基の存在下、不活性溶媒の存在下又は不存在下に反応させ、一般式(I-3)で表されるアミド誘導体を製造することができる。

[0034] [2-1] 一般式(I-1)→ 一般式(I-2)

本反応で使用できる不活性溶媒としては、反応を著しく阻害しないものであれば特に限定されず、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素；クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類；アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン等のケトン類；クロロホルム、ジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類；酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類；テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、メチルtert-ブチルエーテル、1, 2-ジメトキシエタン、1, 4-ジオキサン等の鎖状又は環状エーテル類；アセトニトリル等のニトリル類；N, N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ジメチルスルホキシド等の極性溶媒等を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

[0035] 本反応で使用できる塩基としては、例えば、水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の金属水素化物；水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物；炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等のアルカリ金属重炭酸塩；ピリジン、N, N-ジメチルアニリン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン、DBU(1, 8-ジアザビスクロ[5. 4. 0]ウンデック-7-エン)、トリエチルアミン、トリブチルアミン等の有機塩基等を挙げることができ、その使用量は一般式(I-1)で表されるアミン誘導体に対して等モル～過剰モルの範囲で適宜選択して反応を行えばよい。

[0036] 反応温度は-50℃～使用する不活性溶媒の沸点域の範囲で適宜行えばよく、好ましくは室温～80℃である。反応時間は反応の規模及び反応温度によって一定しないが、数分～100時間の範囲である。本反応は等モル反応であるので一般式(I-1

WO 2007/125984

20

PCT/JP2007/059040

)で表されるアミン誘導体及び一般式(V-1)又は(V-2)で表される酸無水物若しくは酸ハロゲン化物又はスルホン酸無水物若しくはスルホン酸ハロゲン化物を等モル使用すれば良いが、いずれかの反応剤を過剰に用いても良い。

反応終了後、[1-2]と同様の単離操作を行うことにより、目的化合物を単離することができる。

[0037] [2-2] 一般式(I-2) → 一般式(I-3)

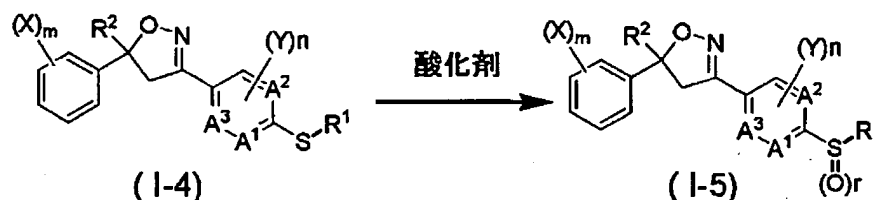
本反応は[2-1]に準じて行えば良い。

[0038] 本発明の原料化合物である一般式(I-1)で表されるイソキサゾリン誘導体は国際公開第05/085216号パンフレットに記載の方法に従って目的物を製造することができる。

[0039] 製造方法3.

本発明の一般式(I)で表されるイソキサゾリン誘導体のうち、Wが-SO-又は-SO₂-で示される化合物(I-5)は、例えば下記に図示する製造方法により製造することができるが、これに限定されるものではない。

[化7]



(式中、R¹、R²、A¹、A²、A³、X、Y、m及びnは前記に同じくし、rは1又は2を示す。)

[0040] 一般式(I-4)で表されるスルフィド誘導体と酸化剤とを不活性溶媒の存在下又は不存在下に反応させることにより一般式(I-5)で表されるスルホキシド誘導体又はスルホン誘導体を製造することができる。

[0041] 本反応で利用できる不活性溶媒としては、反応を著しく阻害しないものであれば特に限定されず、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素；アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン等のケトン類；クロロホルム、ジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類；水；酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類；ギ酸、酢

酸、トリフルオロ酢酸等の有機酸類;アセトニトリル、N, N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン等の極性溶媒等を挙げることができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種類以上を混合して使用することができる。

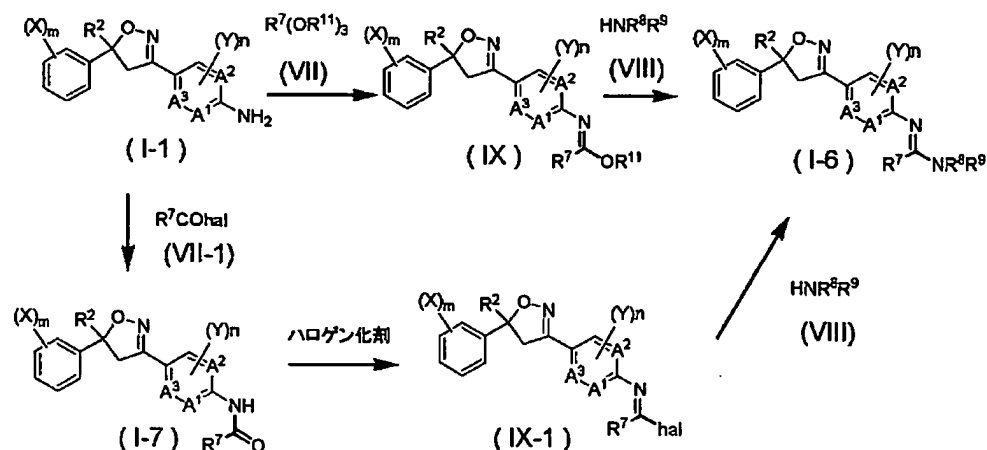
[0042] 本反応で使用する酸化剤としてはm-クロロ安息香酸、過酸化水素、過酢酸等を挙げることができる。本反応は等モル反応であるので一般式(I-4)で表されるスルフィド誘導体及び酸化剤を等モル使用すればよいが、いずれかの反応剤を過剰に使用することもでき、好ましくは酸化剤を過剰に使用するのが良い。反応温度は-50℃～使用する不活性溶媒の沸点域の範囲で適宜行えば良く、好ましくは0℃～25℃の範囲である。反応時間は反応の規模及び反応温度により一定しないが、数分～48時間の範囲である。

反応終了後、[1-2]と同様の単離操作を行うことにより、目的化合物を単離することができる。

[0043] 製造方法4.

本発明の一般式(I)で表されるイソキサゾリン誘導体のうち、Wが $N=C(R^7)NR^8R^9$ で示される化合物は、例えば下記に図示する製造方法により製造することができるが、これに限定されるものではない。

[化8]



(式中、 R^1 、 R^2 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、X、Y、hal、m及びnは前記に同じくし、 R^1 は $(C_1 \sim C_3)$ アルキル基を示す。)

WO 2007/125984

22

PCT/JP2007/059040

一般式(I-1)で表されるアミン誘導体と一般式(VII)で表されるオルトエステル類とを不活性溶媒の存在下又は不存在下に反応させて、一般式(IX)で表されるイミデート誘導体とし、該イミデート誘導体を単離し又は単離せずして、不活性溶媒中で一般式(VIII)で表されるアミン類と反応させることにより一般式(I-6)で表される本発明化合物を製造することができる。

また、一般式(I-1)で表されるアミン誘導体と一般式(VII-1)で表される酸ハロゲン化物とを塩基の存在下、不活性溶媒の存在下又は不存在下に反応させて、一般式(I-7)で表されるアミド誘導体とし、該アミド誘導体を単離し又は単離せずして、不活性溶媒の存在下又は不存在下にハロゲン化剤と反応させて一般式(IX-1)で表されるイミドイルハライド誘導体とし、該イミドイルハライド誘導体を単離し又は単離せずして、不活性溶媒中で一般式(VIII)で表されるアミン類と反応させることにより一般式(I-6)で表される本発明化合物を製造することができる。

[0044] [4-1] 一般式(I-1)→ 一般式(IX)

本反応で利用できるオルトエステル類としては、オルト蟻酸メチル、オルト蟻酸エチル、オルト酢酸メチル、オルト酢酸エチル等の低級脂肪酸の低級アルキルオルトエステルが挙げられるが、これらに限定されるものではない。本反応には、本反応を阻害しない不活性溶媒を使用することもできるが、反応剤であるオルトエステル類を溶媒として使用することが好ましい。

反応温度は室温から使用する不活性溶媒又はオルトエステル類の沸点域の範囲で適宜行えばよく、好ましくは60℃～120℃の範囲である。反応時間は反応の規模及び反応温度によって一定しないが、数分～100時間の範囲である。本反応は等モル反応であるので一般式(I-1)で表されるアミン誘導体と一般式(VII)で表されるオルトエステル類を等モル使用すれば良いが、オルトエステル類を大過剰使用するのが好ましい。

反応終了後、不活性溶媒又は未反応のオルトエステル類を留去することにより、一般式(IX)で表されるイミデート誘導体を単離することができる。また、必要に応じて完全に留去できないオルトエステル類等をトルエン等を加えて共沸留去することができる。

[0045] [4-2] 一般式(IX) → 一般式(I-6)

本反応で使用できる不活性溶媒としては、反応を著しく阻害しないものであれば特に限定されず、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素；クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類；メタノール、エタノール、イソプロピルアルコール等のアルコール類；テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、メチルtert-ブチルエーテル、1, 2-ジメトキシエタン、1, 4-ジオキサン等の鎖状又は環状エーテル類；アセトニトリル等のニトリル類；N, N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ジメチルスルホキシド、水等の極性溶媒等を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

反応温度は0℃～使用する不活性溶媒の沸点域の範囲で適宜行えばよく、好ましくは室温～80℃の範囲である。反応時間は反応の規模及び反応温度によって一定しないが、数分～100時間の範囲である。本反応は等モル反応であるので一般式(I X)で表されるイミデート誘導体と一般式(VIII)で表されるアミン類を等モル使用すれば良いが、いずれかの反応剤を過剰に使用することもでき、好ましくは一般式(VIII)で表されるアミン類を過剰に使用するのが良い。

反応終了後、目的物を単離するには不活性溶媒を留去し、必要に応じて再結晶、懸濁洗浄、カラムクロマトグラフィー等で精製すれば良い。

[4-3] 一般式(I-1) → 一般式(I-7)

本反応は[2-1]と同様に行えば良い。

[4-4] 一般式(I-7) → 一般式(IX-1)

本反応で使用できるハロゲン化剤としては、オキシ塩化リン、オキシ臭化リン、3塩化リン、5塩化リン、3臭化リン、5臭化リン、塩化チオニル、臭化チオニル等を挙げることができるが、これらに限定されるものではない。ハロゲン化剤の使用量は、一般式(I-7)で表されるアミド誘導体に対して当量～5当量の範囲で適宜選択して使用すれば良いが、好ましくは1. 2当量～2当量の範囲である。

本反応で使用できる不活性溶媒としては、反応を著しく阻害しないものであれば特に限定されず、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素；クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類；アセトン、メチルエチルケ

WO 2007/125984

24

PCT/JP2007/059040

トン、メチルイソブチルケトン等のケトン類；クロロホルム、ジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類；テトラヒドロフラン、1, 4-ジオキサン等の環状エーテル類；アセトニトリル等のニトリル類等を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

反応温度は50℃～使用する不活性溶媒の沸点域の範囲で適宜行えばよく、好ましくは80～120℃の範囲である。反応時間は反応の規模及び反応温度によって一定しないが、数分～100時間の範囲である。反応終了後、一般式(IX-1)で表されるイミドイルハライド誘導体は[1-2]と同様の単離操作を行うことにより、単離・精製することができるが、精製せずに不活性溶媒を留去するだけで、次の反応に使用することが好ましい。

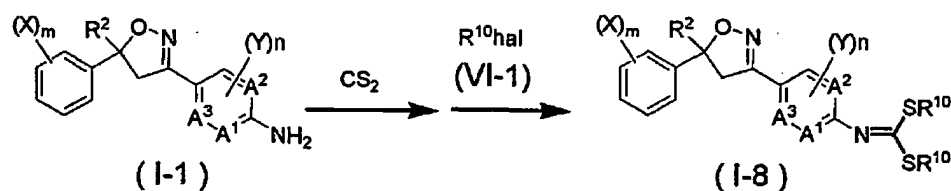
[4-5] 一般式(IX-1) → 一般式(I-6)

本反応は[2-1]と同様に行えば良い。

[0046] 製造方法5.

本発明の一般式(I)で表されるイソキサゾリン誘導体のうち、Wが $N=C(S^{10})_2$ で示される化合物は、例えば下記に図示する製造方法により製造することができるが、これに限定されるものではない。

[化9]



(式中、 R^2 、 R^{10} 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、X、Y、hal、m及びnは前記に同じ。)

一般式(I-1)で表されるアミン誘導体を塩基の存在下、不活性溶媒の存在下又は不存在下に二硫化炭素と反応させてジチオラートとし、該ジチオラートを単離することなく一般式(VI-1)で表されるハロゲン化物と反応させることにより一般式(I-8)で表される本発明化合物を製造することができる。

本反応で使用できる不活性溶媒としては、反応を著しく阻害しないものであれば特

WO 2007/125984

25

PCT/JP2007/059040

に限定されず、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素；クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類；アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン等のケトン類；クロロホルム、ジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類；酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類；テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、メチルtert-ブチルエーテル、1, 2-ジメトキシエタン、1, 4-ジオキサン等の鎖状又は環状エーテル類；アセトニトリル等のニトリル類；N, N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ジメチルスルホキシド、水等の極性溶媒等を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

[0047] 本反応で使用できる塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物；炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等のアルカリ金属重炭酸塩；ピリジン、N, N-ジメチルアニリン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン、DBU (1, 8-ジアザビシクロ[5. 4. 0]ウンデック-7-エン)、トリエチルアミン、トリブチルアミン等の有機塩基等を挙げることができ、その使用量は一般式(I-1)で表されるアミン誘導体に対して等モルから過剰モルの範囲で適宜選択して反応を行えばよい。

[0048] 反応温度は0℃～使用する不活性溶媒の沸点域の範囲で適宜行えばよく、好ましくは室温～80℃の範囲である。反応時間は反応の規模及び反応温度によって一定しないが、数分～100時間の範囲である。本反応は等モル反応であるので一般式(I-1)で表されるアミン誘導体、二硫化炭素及び(VI-1)で表されるハロゲン化物を等モル使用すれば良いが、いずれかの反応剤を過剰に用いても良い。

反応終了後、[1-2]と同様の単離操作を行うことにより、目的化合物を単離することができる。

[0049] 製造方法6.

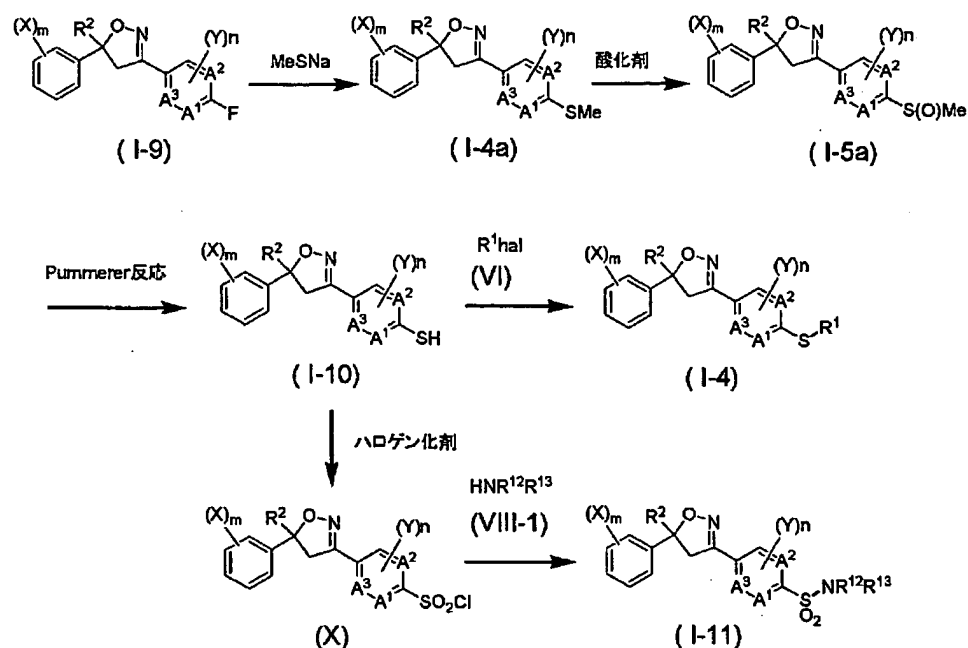
本発明の一般式(I)で表されるイソキサゾリン誘導体のうち、Wが硫黄原子又はW-R¹がSO₂NR¹²R¹⁰で示される化合物は、例えば下記に図示する製造方法により製造することができるが、これに限定されるものではない。

[化10]

WO 2007/125984

26

PCT/JP2007/059040



(式中、 R^1 、 R^2 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、X、Y、hal、m及びnは前記に同じくし、 R^{12} 及び R^{13} は同一又は異なっても良く、水素原子、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキル基又はZ(Zは前記に同じ。)により置換された $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキル基を示す。)

一般式(I-9)で表されるフッ素化合物とソディウムチオメトキシドとを不活性溶媒の存在下に反応させて一般式(I-4a)で表されるスルフィド誘導体とし、該スルフィド誘導体を単離し又は単離することなく不活性溶媒の存在下に酸化剤と反応させて一般式(I-5a)で表されるスルホキシド誘導体とし、該スルフィド誘導体を単離し又は単離することなくPummerer反応により、一般式(I-10)で表されるチオール誘導体とし、該チオール誘導体を単離し又は単離することなく一般式(VI)で表されるハロゲン化合物と塩基及び不活性溶媒の存在下に反応させることにより、一般式(I-4)で表される本発明化合物を製造することができる。

また、一般式(I-10)で表されるチオール誘導体をハロゲン化剤と反応させて一般式(X)で表されるスルホニルハライド誘導体とし、該スルホニルハライド誘導体を単離し又は単離することなく一般式(VIII-1)で表されるアミン類と塩基及び不活性溶媒の存在下に反応させることにより、一般式(I-11)で表される本発明化合物を製造す

WO 2007/125984

27

PCT/JP2007/059040

ることができる。

[0050] [6-1]一般式(I-9)→ 一般式(I-4a)

本反応で使用できる不活性溶媒としては、反応を著しく阻害しないものであれば特に限定されず、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素；クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類；テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、メチルtertブチルエーテル、1, 2-ジメトキシエタン、1, 4-ジオキサン等の鎖状又は環状エーテル類；アセトニトリル等のニトリル類；N, N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ジメチルスルホキシド、水等の極性溶媒等を例示することができる、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

反応温度は0℃～使用する不活性溶媒の沸点域の範囲で適宜行えばよく、好ましくは室温～80℃の範囲である。反応時間は反応の規模及び反応温度によって一定しないが、数分～100時間の範囲である。本反応は等モル反応であるので一般式(I-9)で表されるフッ素化合物及びソディウムチオメチキンドを等モル使用すれば良いが、いずれかの反応剤を過剰に用いても良い。

反応終了後、[1-2]と同様の単離操作を行うことにより、目的化合物を単離することができるが、単離せずに次の反応に用いることもできる。

[0051] [6-2]一般式(I-4a)→ 一般式(I-5a)

本反応は製造方法3と同様に行えば良い。

[0052] [6-3]一般式(I-5a)→ 一般式(I-10)

本反応はPummerer反応又はPummerer転位として周知の製造方法であり、公知文献(例えば、Chem. Ber. , 43, p. 1401(1910)、Org. React. , 40, p. 157(1991)又はJ. Am. chem. Soc. , 106, p. 4186(1984)等を参照。)記載の方法に準じて行うことができる。

[0053] [6-4]一般式(I-10)→ 一般式(I-4)

本反応は[2-1]と同様に行えば良い。

[0054] [6-5]一般式(I-10)→ 一般式(X)

本反応は[1-1]と同様に行えば良い。

WO 2007/125984

28

PCT/JP2007/059040

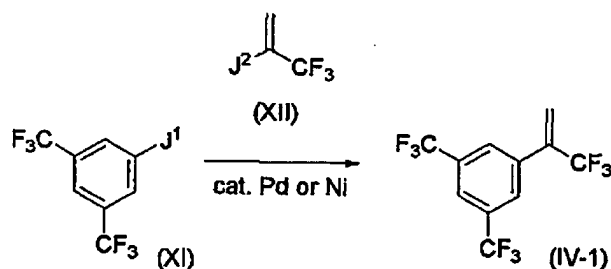
[0055] [6-6]一般式(X)→ 一般式(I-11)

本反応は[2-1]と同様に行えば良い。

[0056] 中間体製造方法1.

本発明化合物の製造中間体である一般式(IV)で表されるオレフィン類のうち、(X)
mが3, 5-ビス(トリフルオロメチル)基を示し、R²がトリフルオロメチル基を示す化合物
(IV-1)は以下に図示する製法により製造することができる。

[化11]



(式中、J¹は塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、(C₁~C₄)アルキルスルホニルオキシ基、ハロ(C₁~C₄)アルキルスルホニルオキシ基、-B(OH)₂基、-B(OMe)₂基、-B(OEt)₂基、4, 4, 5, 5-テトラメチル-1, 3, 2-ジオキサボラン-2-イル基、-Si(OEt)₃基、-ZnCl基、-ZnBr基、-ZnI基、-MgCl基、-MgBr基又は-MgI基等の脱離基を示す。J²は塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、-B(OH)₂基、-B(OMe)₂基、-B(OEt)₂基等の脱離基を示す。)

一般式(XI)で表される3, 5-ビス(トリフルオロメチル)ベンゼン誘導体と一般式(XII)で表されるオレフィン類とを、パラジウム、ニッケル等の遷移金属触媒の存在下、配位子及び塩基の存在下又は不存在下に不活性溶媒中でクロスカップリングさせることにより製造することができる。

本反応は公知文献(例えば、米国特許2909509号公報、J. Org. Chem. , 24, p. 238~239(1959)、Chem. Rev. , 95, p. 2457(1995)又はBull. Chem. Soc. Jpn. , 49, p. 1958(1976)等を参照。)記載の方法に準じて製造することができる。

本反応で使用できる触媒としては、0価若しくは2価の配位状態を有する各種パラ

ジウム又はニッケル錯体を挙げる事ができる。本反応で使用する配位子としては、トリ-*n*-ブチルホスフィン、トリシクロヘキシルホスフィン、トリフェニルホスフィン、トリ-*o*-トリルホスフィン、1, 2-ビスジフェニルホスフィノエタン、1, 3-ビスジフェニルホスフィノプロパン、1, 4-ビスジフェニルホスフィノブタン等のリン配位子、ナフチリジン、テトラメチルエチレンジアミン、8-オキソキノリン等の含窒素配位子を挙げる事ができるが、これらに限定されるものではない。配位子の使用量はパラジウム又はニッケル触媒1モルに対して、0. 1~100倍モルの範囲で適宜選択すればよいが、好ましくは2~10倍モルの範囲であるが、配位子を使用せずに反応を行うこともできる。

本反応で使用する塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物；炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等のアルカリ金属重炭酸塩；ピリジン、*N*, *N*-ジメチルアニリン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン、DBU(1, 8-ジアザビシクロ[5. 4. 0]ウンデック-7-エン)、トリエチルアミン、トリブチルアミン等の有機塩基等を挙げる事ができ、その使用量は一般式(XI)で表される3, 5-ビス(トリフルオロメチル)ベンゼン誘導体に対して等モルから過剰モルの範囲で適宜選択して反応を行えばよい。

本反応で使用する不活性溶媒としては、反応を著しく阻害しないものであれば特に限定されず、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素；アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン等のケトン類；クロロホルム、ジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類；水；酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類；ギ酸、酢酸、トリフルオロ酢酸等の有機酸類；アセトニトリル、*N*, *N*-ジメチルホルムアミド、*N*-メチルピロリドン等の極性溶媒等を挙げる事ができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種類以上を混合して使用することができる。反応温度は-50℃~使用する不活性溶媒の沸点域の範囲で適宜行えばよく、好ましくは室温~80℃の範囲である。反応時間は反応の規模及び反応温度によって一定しないが、数分~100時間の範囲である。

[0057] 一般式(I)で表されるイソキサゾリン誘導体の代表的な化合物を第1表乃至第8表に例示するが、本発明はこれらに限定されるものではない。又、表中の「物性値」欄には融点(℃)又は屈折率[n_D (℃)]を記載した。「物性値」欄にNMRと記載した化合

WO 2007/125984

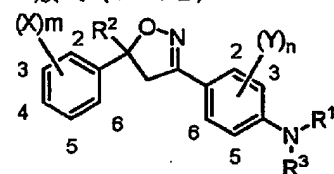
30

PCT/JP2007/059040

物については、その¹HNMRデータを第9表に記載した。尚、表中「i-」はイソを、「c-」はシクロを、「Me」はメチル基を、「Et」はエチル基を、「Pr」はプロピル基を、「Ph」はフェニル基を、「Py」はピリジル基を示す。

[0058] [表1-1]

一般式 (I-12)



(I-12)

第1表 ($R^2 = CF_3$)

No.	X	R ¹	R ³	Y _n	物性値
1-1	3,5-Cl ₂	H	CF ₃ CO	H	1.5222(22.0)
1-2	3,5-Cl ₂	H	CF ₃ CO	3-Cl	151-153
1-3	3,5-Cl ₂	H	CF ₃ CO	3,5-Cl ₂	59-61
1-4	3,5-Cl ₂	H	CF ₃ CF ₂ CO	H	109-111
1-5	3,5-Cl ₂	Me	CF ₃ CO	H	1.5384(19.8)
1-6	3,5-Cl ₂	H	(CCl ₃ CH ₂ O)CO	H	161-163
1-7	3,5-Cl ₂	H	MeCO	H	237-239
1-8	3,5-Cl ₂	Me	MeCO	H	135-140
1-9	3,5-Cl ₂	H	c-PrCO	H	117-119
1-10	3,5-Cl ₂	Me	c-PrCO	H	52-60
1-11	3,5-Cl ₂	H	PhCO	H	188-195
1-12	3,5-Cl ₂	Me	PhCO	H	1.3220(20.4)
1-13	3,5-Cl ₂	H	PhCH ₂ CO	H	211-214
1-14	3,5-Cl ₂	H	2-PyCO	H	184-186
1-15	3,5-Cl ₂	Me	PhCH ₂ CO	H	1.5751(22.5)
1-16	3,5-Cl ₂	Me	2-PyCO	H	1.5802(22.5)
1-17	3,5-Cl ₂	CH ₂ CHCH ₂	c-PrCO	H	1.5291(25.5)
1-18	3,5-Cl ₂	MeOCO	c-PrCO	H	61-65
1-19	3,5-Cl ₂	c-PrCO	c-PrCO	H	1.4080(24.7)
1-20	3,5-Cl ₂	PhCO	c-PrCO	H	1.3439(25.7)
1-21	3,5-Cl ₂	H	c-PrCO	3-Me	64-70
1-22	3,5-Cl ₂	Me	c-PrCO	3-Me	1.5431(27.5)
1-23	3,5-Cl ₂	H	CF ₃ CO	3-Me	1.5240(25.0)
1-24	3,5-Cl ₂	c-PrCO	c-PrCO	3,5-Br ₂	1.5796(26.6)
1-25	3,5-Cl ₂	H	c-PrCO	3-Br	1.5765(27.7)
1-26	3,5-Cl ₂	c-PrCO	c-PrCO	3-Br	1.5620(27.1)
1-27	3,5-Cl ₂	Me	CF ₃ CO	3-Me	1.5299(27.1)

WO 2007/125984

31

PCT/JP2007/059040

[0059] [表1-2]

第1表 (続き)

No.	X	R ¹	R ²	Yn	物性値
1-28	3,5-Cl ₂	H	H	3,5-Br ₂	1.6102(27.5)
1-29	3,5-Cl ₂	H	c-PrCO	3-Ph	1.5185(28.2)
1-30	3,5-Cl ₂	Me	c-PrCO	3-Ph	81-85
1-31	3,5-Cl ₂	H	MeOCH ₂ CO	H	1.5622(26.6)
1-32	3,5-Cl ₂	H	ClCH ₂ CO	H	1.5859(27.6)
1-33	3,5-Cl ₂	H	MeSCH ₂ CO	H	142-146
1-34	3,5-Cl ₂	H	MeSO ₂ CH ₂ CO	H	206-208
1-35	3,5-Cl ₂	H	MeSOCH ₂ CO	H	78-85
1-36	3,5-Cl ₂	H	H	3-MeO	139-140
1-37	3,5-Cl ₂	H	c-PrCO	3-MeO	179-181
1-38	3,5-Cl ₂	Me	c-PrCO	3-MeO	1.5425(25.6)
1-39	3,5-Cl ₂	H	c-PrCS	H	1.5943(26.2)
1-40	3,5-Cl ₂	H	CF ₃ CO	3-MeO	130-134
1-41	3,5-Cl ₂	Me	CF ₃ CO	3-MeO	1.5199(26.0)
1-42	3,5-Cl ₂	H	c-PrCO	3-CN	176-179
1-43	3,5-Cl ₂	H	PhOCH ₂ CO	H	167-169
1-44	3,5-Cl ₂	H	MeOCH ₂ CO	3-Me	161-163
1-45	3,5-Cl ₂	H	MeOCH ₂ CO	3-MeO	184-186
1-46	3,5-Cl ₂	H	MeOCH ₂ CO	3-Br	148-151
1-47	3,5-Cl ₂	Me	MeOCH ₂ CO	H	1.5641(25.6)
1-48	3,5-Cl ₂	Me	MeOCH ₂ CO	3-Me	1.5152(25.6)
1-49	3,5-Cl ₂	Me	MeOCH ₂ CO	3-MeO	1.5339(25.6)
1-50	3,5-Cl ₂	Me	MeOCH ₂ CO	3-Br	1.5480(25.6)
1-51	3,5-Cl ₂	H	2-PyCH ₂ CO	H	187-192
1-52	3,5-Cl ₂	H	3-PyCH ₂ CO	H	218-220
1-53	3,5-Cl ₂	H	2-PyCH ₂ CO	3-Me	147-150
1-54	3,5-Cl ₂	H	3-PyCH ₂ CO	3-Me	159-162
1-55	3,5-Cl ₂	H	2-PyCH ₂ CO	3-MeO	86-92
1-56	3,5-Cl ₂	H	3-PyCH ₂ CO	3-MeO	141-145
1-57	3,5-Cl ₂	H	TriazolylCH ₂ CO	H	1.5744(27.0)
1-58	3,5-Cl ₂	H	4-PySCO	H	172-174
1-59	3,5-Cl ₂	H	4-PySCH ₂ CO	3-Me	68-74
1-60	3,5-Cl ₂	H	4-PySCH ₂ CO	3-MeO	1.5802(27.5)
1-61	3,5-Cl ₂	H	4-PyCO	H	1.5468(25.7)

[0060] [表1-3]

WO 2007/125984

32

PCT/JP2007/059040

第1表 (続き)

No.	X	R ¹	R ³	Y _n	物性値
1-62	3,5-Cl ₂	Me	1-TriazolylCH ₂ CO	H	1.5699(25.7)
1-63	3,5-Cl ₂	H	3-PyCO	H	168-170
1-64	3,5-Cl ₂	Me	ClCH ₂ CO	H	1.5581(25.7)
1-65	3,5-Cl ₂	Me	H	H	119-121
1-66	3,5-Cl ₂	Me	2-PyCH ₂ CO	H	1.5703(27.2)
1-67	3,5-Cl ₂	Me	3-PyCH ₂ CO	H	1.5801(27.2)
1-68	3,5-Cl ₂	Me	4-PyCH ₂ CO	H	1.5809(27.2)
1-69	3,5-Cl ₂	Me	Me	H	1.5718(26.8)
1-70	3,5-Cl ₂	H	CHO	H	209-213
1-71	3,5-Cl ₂	Me	CHO	H	135-138
1-72	3,5-Cl ₂	H	MeNHCS	H	1.5792(26.8)
1-73	3,5-Cl ₂	H	H	Cl	153-155
1-74	3,5-Cl ₂	H	2-PySCH ₂ CO	H	1.5739(24.6)
1-75	3,5-Cl ₂	H	CHS	H	1.5568(24.6)
1-76	3,5-Cl ₂	Me	CN	H	180-181
1-77	3,5-Cl ₂	HCO	MeCO	H	1.5230(25.2)
1-78	3,5-Cl ₂	H	Me ₂ NCH ₂ CO	H	173-176
1-79	3,5-Cl ₂	H	MorpholinoCH ₂ CO	H	165-167
1-80	3,5-Cl ₂	H	PhMeNCH ₂ CO	H	181-185
1-81	3,5-(CF ₃) ₂	H	MeOCH ₂ CO	H	127-128
1-82	3,5-(CF ₃) ₂	H	c-PrCO	H	1.4145(24.7)
1-83	3,5-(CF ₃) ₂	H	2-PyCO	H	159-162
1-84	3,5-(CF ₃) ₂	H	3-PyCO	H	203-207
1-85	3,5-(CF ₃) ₂	H	CHO	H	176-178
1-86	3,5-(CF ₃) ₂	H	H	H	1.4416(20.7)
1-87	3,5-(CF ₃) ₂	Me	CHO	H	145-146
1-88	3,5-Cl ₂	H	CHO	3-CN	191-193
1-89	3,5-(CF ₃) ₂	H	MeCO	H	1.4769(20.7)
1-90	3,5-(CF ₃) ₂	Me	MeCO	H	1.4961(20.3)
1-91	3,5-(CF ₃) ₂	H	MeCS	H	1.5427(21.6)
1-92	3,5-Cl ₂	H	MeSO ₂	H	1.5514(20.6)
1-93	3,5-Cl ₂	H	PhSO ₂	H	68-74
1-94	3,5-Cl ₂	Me	MeSO ₂	H	137-139
1-95	3,5-Cl ₂	Me	PhSO ₂	H	1.4425(23.2)

[0061] [表1-4]

第1表 (続き)

No.	X	R ¹	R ³	Yn	物性値
1-96	3,5-Cl ₂	H	Me ₂ NSO ₂	H	1.3245(20.6)
1-97	3,5-Cl ₂	Me	Me ₂ NSO ₂	H	1.3296(22.6)
1-98	3,5-Cl ₂	H	CF ₃ SO ₂	H	1.3215(25.5)
1-99	3,5-Cl ₂	Me	CF ₃ SO ₂	H	176-179
1-100	3,5-Cl ₂	-	Me ₂ NCH=	H	131-136
1-101	3,5-Cl ₂	-	Me ₂ NCH=	3-Me	1.6000(25.7)
1-102	3,5-Cl ₂	-	Me ₂ NCH=	3-MeO	1.5269(24.9)
1-103	3,5-Cl ₂	-	Me ₂ N(Me)C=	H	1.5928(27.2)
1-104	3,5-Cl ₂	-	Me ₂ N(Me)C=	3-Me	1.5030(27.5)
1-105	3,5-Cl ₂	-	Me ₂ N(Me)C=	3-MeO	1.5823(27.5)
1-106	3,5-Cl ₂	-	Et ₂ N(Me)C=	H	1.5729(27.5)
1-107	3,5-Cl ₂	-	Morpholino(Me)C=	H	154-158
1-108	3,5-Cl ₂	-	EtMeN(Me)C=	H	1.5990(28.1)
1-109	3,5-Cl ₂	-	Pyrrolidino(Me)C=	H	1.5106(28.1)
1-110	3,5-Cl ₂	-	4-Acetylpiperazino(Me)C=	H	235-239
1-111	3,5-Cl ₂	-	Piperidino(Me)C=	H	1.6000(28.1)
1-112	3,5-Cl ₂	-	Pyrrolidino(c-Pr)C=	H	112-117
1-113	3,5-Cl ₂	-	PhCH ₂ (Me)N(c-Pr)C=	H	1.6059(28.1)
1-114	3,5-Cl ₂	-	Morpholino(c-Pr)C=	H	1.5888(28.1)
1-115	3,5-Cl ₂	-	4-Acetylpiperazino(c-Pr)C=	H	1.5919(28.1)
1-116	3,5-Cl ₂	-	Et ₂ N(MeOCH ₂)C=	3-Me	1.5797(28.1)
1-117	3,5-Cl ₂	-	Et ₂ N(MeOCH ₂)C=	H	1.5848(28.1)
1-118	3,5-Cl ₂	-	Pyrrolidino(MeOCH ₂)C=	H	1.5945(28.1)
1-119	3,5-Cl ₂	-	Morpholino(MeOCH ₂)C=	H	1.5917(28.1)
1-120	3,5-Cl ₂	-	MorpholinoCH=	H	1.5829(28.1)
1-121	3,5-Cl ₂	-	Et ₂ NCH=	H	1.5972(28.1)
1-122	3,5-Cl ₂	-	PyrrolidinoCH=	H	1.5870(28.1)
1-123	3,5-Cl ₂	-	Me ₂ NCH=	3-Br	1.5905(26.3)
1-124	3,5-Cl ₂	-	PyrrolidinoCH=	3-Br	1.6002(26.3)
1-125	3,5-Cl ₂	-	MorpholinoCH=	3-Br	1.5935(26.3)
1-126	3,5-Cl ₂	-	PiperidinoCH=	3-Br	1.6093(26.3)
1-127	3,5-Cl ₂	-	MeHNCH=	H	143-147
1-128	3,5-Cl ₂	-	Me ₂ NCH=	3-Cl	1.6330(27.0)
1-129	3,5-Cl ₂	-	PyrrolidinoCH=	3-Cl	1.5903(27.0)

[0062] [表1-5]

WO 2007/125984

34

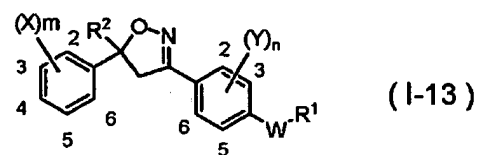
PCT/JP2007/059040

第1表 (続き)

No.	X	R ¹	R ³	Y _n	物性値
1-130	3,5-Cl ₂	-	MorpholinoCH=	3-Cl	1.6001(27.0)
1-131	3,5-Cl ₂	-	PiperidinoCH=	3-Cl	1.6037(27.0)
1-132	3,5-Cl ₂	-	MeONHCH=	H	158-160
1-133	3,5-Cl ₂	-	PhMeNCH=	H	127-129
1-134	3,5-Cl ₂	-	PhCH ₂ ONHCH=	H	1,6005(26.0)
1-135	3,5-Cl ₂	-	4-EthylpiperazinoCH=	H	134-137
1-136	3,5-Cl ₂	-	ThiomorpholinoCH=	H	177-180
1-137	3,5-Cl ₂	-	4-OxothiomorpholinoCH=	H	1.6001(25.9)
1-138	3,5-Cl ₂	-	PiperazinoCH=	H	1.5829(25.2)
1-139	3,5-Cl ₂	-	4-(PhCO)piperazinoCH=	H	1.5641(25.6)
1-140	3,5-Cl ₂	-	4-(PhSO ₂)piperazinoCH=	H	225-230
1-141	3,5-Cl ₂	-	4-(Ph)piperazinoCH=	H	1.4906(24.6)
1-142	3,5-Cl ₂	-	4-(4-CF ₃ -Ph)piperazinoCH=	H	184-186
1-143	3,5-(CF ₃) ₂	-	Me ₂ NCH=	H	1.5628(22.2)
1-144	3,5-(CF ₃) ₂	-	MorpholinoCH=	H	149-151
1-145	3,5-Cl ₂	-	Me ₂ NCH=	3-CN	1.6032(20.2)
1-146	3,5-Cl ₂	-	MorpholinoCH=	3-CN	95-100
1-147	3,5-(CF ₃) ₂	-	HC≡CCH ₂ MeNCH=	H	1.5328(20.3)
1-148	3,5-(CF ₃) ₂	-	MeOCH ₂ CH ₂ MeNCH=	H	1.5321(20.3)
1-149	3,5-(CF ₃) ₂	-	NCCH ₂ CH ₂ MeNCH=	H	1.5674(20.3)
1-150	3,5-(CF ₃) ₂	-	2-PyCH ₂ CH ₂ MeNCH=	H	1.5447(20.3)
1-151	3,5-Cl ₂	-	HC≡CCH ₂ MeNCH=	H	1.6077(19.0)
1-152	3,5-Cl ₂	-	MeOCH ₂ CH ₂ MeNCH=	H	1.5761(19.0)
1-153	3,5-Cl ₂	-	NCCH ₂ CH ₂ MeNCH=	H	1.5971(19.0)
1-154	3,5-Cl ₂	-	2-PyCH ₂ CH ₂ MeNCH=	H	1.6100(19.0)
1-155	3,5-Cl ₂	-	PhCH=	H	128-132
1-156	3,5-Cl ₂	-	(MeS) ₂ C=	H	1.6234(27.0)
1-157	3,5-Cl ₂	-	3-PyCH=	H	160-163
1-158	3,5-Cl ₂	-	4-PyCH=	H	159-162
1-159	3,5-(CF ₃) ₂	-	(MeS) ₂ C=	H	1.5474(20.3)
1-161	3,5-Cl ₂	-	HC≡CCH ₂ MeNCH=	3-CN	1.5592(20.2)
1-162	3,5-Cl ₂	-	NCCH ₂ CH ₂ MeNCH=	3-CN	1.5629(20.2)
1-163	3,5-Cl ₂	-	2-PyCH ₂ CH ₂ MeNCH=	3-CN	1.5941(20.2)

[0063] [表2-1]

一般式 (I-13)



第2表 ($R^2 = CF_3$)

No.	X ^m	Y ⁿ	W	R ¹	物性値
2-1	3,5-Cl ₂	H	SO ₂	Me	180-181
2-2	3,5-Cl ₂	H	S	CF ₃	111-112
2-3	3,5-Cl ₂	H	S	Me	117-118
2-4	3-Cl-5-SMe	H	S	Me	80-81
2-5	3,5-Cl ₂	H	SO	Me	1.5653(23.0)
2-6	3-Cl-5-SO ₂ Me	H	SO ₂	Me	NMR
2-7	3,5-Cl ₂	H	SO ₂	CF ₃	147-148
2-8	3,5-Cl ₂	H	SO	CF ₃	160-161
2-9	3,5-Cl ₂	3-Br	S	Me	156-157
2-10	3,5-Cl ₂	3-Me	S	Me	117-118
2-11	3,5-Cl ₂	3-F	S	Me	126-127
2-12	3,5-Cl ₂	H	S	Et	77-78
2-13	3-Cl-5-SMe	3-Me	S	Me	1.6190(23.0)
2-14	3,5-Cl ₂	H	SO ₂	N(Me) ₂	1.5525(23.0)
2-15	3,5-Cl ₂	H	SO ₂	Et	142-143
2-16	3,5-Cl ₂	H	SO	Et	136-137
2-17	3,5-Cl ₂	3-Me	SO ₂	Me	185-186
2-18	3,5-Cl ₂	3-Me	SO	Me	NMR
2-19	3-Cl-5-SO ₂ Me	3-Me	SO ₂	Me	172-173
2-20	3,5-Cl ₂	3-Me	SO ₂	2-PyCH ₂ NH	NMR
2-21	3,5-Cl ₂	3-Me	SO ₂	N(Me) ₂	158-159
2-22	3,5-Cl ₂	3-Me	S	2-PyCH ₂	NMR
2-23	3,5-Cl ₂	3-Cl	S	Me	150-151
2-24	3,5-Cl ₂	3-F	SO ₂	Me	179-180
2-25	3,5-Cl ₂	3-F	SO	Me	131-132
2-26	3,5-Cl ₂	3-Cl	SO ₂	Me	198-199
2-27	3,5-Cl ₂	3-Cl	SO	Me	139-140

[0064] [表2-2]

WO 2007/125984

36

PCT/JP2007/059040

第2表 (続き)

No.	Xm	Yn	W	R'	物性値
2-28	3,5-Cl ₂	3-Br	SO ₂	Me	182-183
2-29	3,5-Cl ₂	3-Br	SO	Me	NMR
2-30	3,5-Cl ₂	3-CF ₃	S	Me	152-153
2-31	3,5-Cl ₂	3-CN	S	Me	178-179
2-32	3,5-Cl ₂	3-PhO	S	Me	102-103
2-33	3-Cl-5-SMe	3-PhO	S	Me	93-94
2-34	3,5-Cl ₂	3,5-F ₂	S	Me	128-129
2-35	3,5-Cl ₂	3-F-5-SMe	S	Me	139-140
2-36	3,5-Cl ₂	3-OMe	S	Me	139-140
2-37	3-Cl-5-SMe	3-OMe	S	Me	127-128
2-38	3,5-Cl ₂	3-PhO	S	Me	1.6005(23.0)
2-39	3,5-Cl ₂	3-(4-CF ₃ O-Ph)	S	Me	1.5767(23.0)
2-40	3,5-Cl ₂	3-(3-CF ₃ O-Ph)	S	Me	1.5745(23.0)
2-41	3,5-Cl ₂	3-(2-CF ₃ O-Ph)	S	Me	1.5765(23.0)
2-42	3,5-F ₂	H	S	Me	140-141
2-43	3-F-5-SMe	H	S	Me	82-83
2-44	3,5-Cl ₂	3-CF ₃	SO ₂	Me	169-170
2-45	3,5-Cl ₂	3-CF ₃	SO	Me	187-188
2-46	3,5-Cl ₂	3-CN	SO ₂	Me	228-229
2-47	3,5-Cl ₂	3-CN	SO	Me	159-160
2-48	3,5-Cl ₂	3-PhO	SO ₂	Me	185-186
2-49	3,5-Cl ₂	3-PhO	SO	Me	NMR
2-50	3,5-Cl ₂	3,5-F ₂	SO ₂	Me	200-201
2-51	3,5-Cl ₂	3,5-F ₂	SO	Me	192-193
2-52	3,5-Cl ₂	3-OMe	SO ₂	Me	170-171
2-53	3,5-Cl ₂	3-OMe	SO	Me	NMR
2-54	3,5-F ₂	H	SO ₂	Me	187-188
2-55	3-F-5-SO ₂ Me	H	SO ₂	Me	160-161
2-56	3,5-(Me) ₂	H	S	Me	99-100
2-57	3,5-(Me) ₂	H	SO	Me	120-121
2-58	3,5-(Me) ₂	H	SO ₂	Me	167-168
2-59	3,5-(CF ₃) ₂	H	S	Me	99-100
2-60	3,5-Cl ₂	3-OCF ₃	S	Me	147-148

[0065] [表2-3]

WO 2007/125984

37

PCT/JP2007/059040

第2表 (続き)

No.	Xm	Yn	W	R'	物性値
2-61	3,5-Cl ₂	3-NO ₂	S	Me	189-190
2-62	3,5-(CF ₃) ₂	H	SO ₂	Me	194-195
2-63	3,5-(CF ₃) ₂	H	SO	Me	130-131
2-64	3,5-Cl ₂	3-OCF ₃	SO ₂	Me	166-167
2-65	3,5-Cl ₂	3-OCF ₃	SO	Me	132-133
2-66	3,5-Cl ₂	3-NO ₂	SO ₂	Me	223-224
2-67	3,5-Cl ₂	3-NO ₂	SO	Me	190-193
2-68	3,4,5-F ₃	H	S	Me	155-156
2-69	3,4,5-F ₃	H	SO ₂	Me	136-137
2-70	3,4,5-F ₃	H	SO	Me	168-169
2-71	3,5-(CF ₃) ₂	3-F	S	Me	116-117
2-72	3,5-(CF ₃) ₂	3-Cl	S	Me	123-124
2-73	3,5-(CF ₃) ₂	3-Br	S	Me	138-139
2-74	3,5-(CF ₃) ₂	3-Me	S	Me	121-122
2-75	3,5-(CF ₃) ₂	3-CF ₃	S	Me	164-165
2-76	3,5-(CF ₃) ₂	3-CN	S	Me	152-153
2-77	3,5-(CF ₃) ₂	3-F	SO ₂	Me	177-178
2-78	3,5-(CF ₃) ₂	3-F	SO	Me	139-140
2-79	3,5-(CF ₃) ₂	3-Cl	SO ₂	Me	148-149
2-80	3,5-(CF ₃) ₂	3-Cl	SO	Me	128-129
2-81	3,5-(CF ₃) ₂	3-Br	SO ₂	Me	124-125
2-82	3,5-(CF ₃) ₂	3-Br	SO	Me	117-118
2-83	3,5-(CF ₃) ₂	3-Me	SO ₂	Me	174-175
2-84	3,5-(CF ₃) ₂	3-Me	SO	Me	118-119
2-85	3,5-(CF ₃) ₂	3-CF ₃	SO ₂	Me	151-152
2-86	3,5-(CF ₃) ₂	3-CF ₃	SO	Me	110-111
2-87	3,5-(CF ₃) ₂	3-CN	SO ₂	Me	179-180
2-88	3,5-(CF ₃) ₂	3-CN	SO	Me	163-164
2-89	3,5-Cl ₂	H	S	CHF ₂	86-87
2-90	3,5-Cl ₂	H	SO ₂	CHF ₂	
2-91	3,5-Cl ₂	H	SO	CHF ₂	
2-92	3,5-(CF ₃) ₂	H	S	CHF ₂	103-104
2-93	3,5-(CF ₃) ₂	H	SO ₂	CHF ₂	159-160

[0066] [表2-4]

WO 2007/125984

38

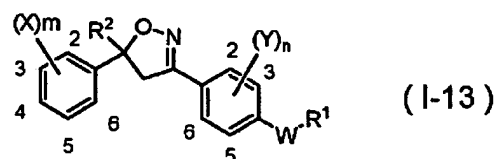
PCT/JP2007/059040

第2表 (続き)

No.	Xm	Yn	W	R ¹	物性値
2-94	3,5-(CF ₃) ₂	H	SO	CHF ₂	126-127
2-95	3,5-Cl ₂	3-Me	S	CHF ₂	
2-96	3,5-Cl ₂	3-Me	SO ₂	CHF ₂	
2-97	3,5-Cl ₂	3-Me	SO	CHF ₂	
2-98	3,5-Cl ₂	3-Br	S	CHF ₂	
2-99	3,5-Cl ₂	3-Br	SO ₂	CHF ₂	
2-100	3,5-Cl ₂	3-Br	SO	CHF ₂	
2-101	3,5-Cl ₂	3-CN	S	CHF ₂	
2-102	3,5-Cl ₂	3-CN	SO ₂	CHF ₂	
2-103	3,5-Cl ₂	3-CN	SO	CHF ₂	
2-104	3,5-(CF ₃) ₂	H	SO	Et	
2-105	3,5-(CF ₃) ₂	H	SO ₂	Et	
					173-174

[0067] [表3-1]

一般式 (I-13)



第3表 ($R^2 = CF_3$)

No.	X _m	Y _n	W	R ¹	物性値
3-1	3,5-Cl ₂	H	O	CF ₃	40-41
3-2	3,5-Cl ₂	H	O	CHF ₂	96-97
3-3	3,5-Cl ₂	3,6-(OMe) ₂	O	Me	137-138
3-4	3,5-Cl ₂	H	O	4-CF ₃ -Ph	100-101
3-5	3,5-Cl ₂	3-Me	O	CHF ₂	102-103
3-6	3,5-Cl ₂	H	O	CH ₂ CF ₃	105-106
3-7	3,5-Cl ₂	3-Me	O	CH ₂ CF ₃	124-125
3-8	3,5-Cl ₂	H	O	CF ₂ CHF ₂	86-87
3-9	3,5-Cl ₂	3-Me	O	CF ₂ CHF ₂	NMR
3-10	3,5-Cl ₂	3-Me	O	C(Me)CF ₃	1.5287(23.0)
3-11	3,5-Cl ₂	3-Me	O	CH ₂ CH=CCl ₂	1.5790(23.0)
3-12	3,5-Cl ₂	3-OMe	O	CHF ₂	107-108
3-13	3,5-Cl ₂	H	O	Me	99-100
3-14	3,5-Cl ₂	F	O	CF ₃	72-73
3-15	3,5-Cl ₂	H	O	4-CF ₃ O-Ph	1.5557(23.0)
3-16	3,5-Cl ₂	H	O	CH ₂ OMe	78-79
3-17	3,5-Cl ₂	3-Me	O	2-PyCH ₂	135-136
3-18	3,5-F ₂	H	O	CHF ₂	72-73
3-19	3,5-(Me) ₂	H	O	CHF ₂	61-62
3-20	3,5-(CF ₃) ₂	H	O	CHF ₂	86-87
3-21	3,4,5-F ₃	H	O	CHF ₂	1.5068(23.0)
3-22	3,5-Cl ₂	3-F	O	CHF ₂	108-109
3-23	3,5-Cl ₂	3-Cl	O	CHF ₂	86-87
3-24	3,5-Cl ₂	3-Br	O	CHF ₂	109-110
3-25	3,5-Cl ₂	3-OEt	O	CHF ₂	121-122
3-26	3,5-Cl ₂	3-CF ₃	O	CHF ₂	119-120
3-27	3,5-Cl ₂	3-CN	O	CHF ₂	125-126

[0068] [表3-2]

WO 2007/125984

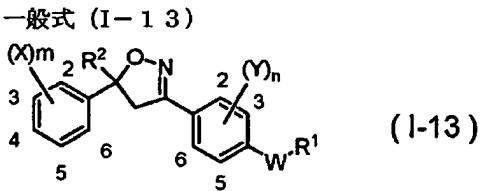
40

PCT/JP2007/059040

第3表 (続き)

No.	Xm	Yn	W	R'	物性値
3-28	3,5-(CF ₃) ₂	3-F	O	CHF ₂	123-124
3-29	3,5-(CF ₃) ₂	3-Cl	O	CHF ₂	80-81
3-30	3,5-(CF ₃) ₂	3-Br	O	CHF ₂	127-128
3-31	3,5-(CF ₃) ₂	3-Me	O	CHF ₂	90-91
3-32	3,5-(CF ₃) ₂	H	O	CF ₂ CHF ₂	65-66
3-33	3,5-F ₂	3-F	O	CHF ₂	79-80
3-34	3,5-F ₂	3-Cl	O	CHF ₂	65-66
3-35	3,5-F ₂	3-Br	O	CHF ₂	98-99
3-36	3,5-F ₂	3-Me	O	CHF ₂	91-92
3-37	3,5-F ₂	H	O	CF ₂ CHF ₂	63-64
3-38	3,5-(CF ₃) ₂	3-CN	O	CHF ₂	110-111
3-39	3,5-F ₂	3-CN	O	CHF ₂	128-129
3-40	3,4,5-F ₃	3-Br	O	CHF ₂	1.5113(23.0)
3-41	3,4,5-F ₃	3-CN	O	CHF ₂	133-134
3-42	3,5-Cl ₂	3-F	O	CF ₂ CHF ₂	
3-43	3,5-Cl ₂	3-Cl	O	CF ₂ CHF ₂	
3-44	3,5-Cl ₂	3-Br	O	CF ₂ CHF ₂	
3-45	3,5-Cl ₂	3-CN	O	CF ₂ CHF ₂	
3-46	3,5-Cl ₂	3-CF ₃	O	CF ₂ CHF ₂	

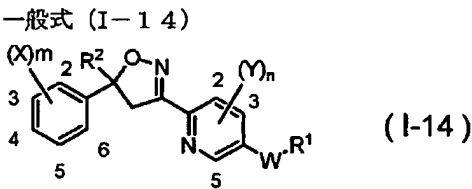
[0069] [表4]



第4表 ($R^2 = CF_3$)

No.	X _m	Y _n	W-R ¹	物性値
4-1	3,5-Cl ₂	H	CF ₃	106-107
4-2	3,5-Cl ₂	2-F	CF ₃	124-125
4-3	3,5-(CF ₃) ₂	H	CF ₃	128-129
4-4	3,5-F ₂	H	CF ₃	83-84
4-5	3,5-Cl ₂	H	CF ₃	
4-6	3,5-Cl ₂	2-Me	CF ₂ CHFCF ₃	
4-7	3,5-Cl ₂	2,3-Me ₂	CF ₃	
4-8	3,5-Cl ₂	3,5-Me ₂	CF ₃	
4-9	3,5-Cl ₂	2,6-Me ₂	CF ₃	
4-10	3,5-Cl ₂	H	i-C ₃ F ₇	
4-11	3,5-Cl ₂	2,3-F ₂	CF ₃	
4-12	3,5-Cl ₂	3,5-F ₂	CF ₃	
4-13	3,5-Cl ₂	2,6-F ₂	CF ₃	
4-14	3,5-Cl ₂	2-Cl	CF ₃	
4-15	3,5-Cl ₂	3-Cl	CF ₃	
4-16	3,5-Cl ₂	3,5-Cl ₂	CF ₃	
4-17	3,5-Cl ₂	2,6-Cl ₂	CF ₃	
4-18	3,5-Cl ₂	2-OMe	CF ₃	
4-19	3,5-Cl ₂	3-OMe	CF ₃	
4-20	3,5-Cl ₂	2,3-(OMe) ₂	CF ₃	
4-21	3,5-Cl ₂	2,6-(OMe) ₂	CF ₃	
4-22	3,5-Cl ₂	2-CF ₃	CF ₃	
4-23	3,5-Cl ₂	3-CF ₃	CF ₃	
4-24	3,5-Cl ₂	2,3-(CF ₃) ₂	CF ₃	
4-25	3,5-Cl ₂	3,5-(CF ₃) ₂	CF ₃	
4-26	3,5-Cl ₂	2-OCF ₃	CF ₃	
4-27	3,5-Cl ₂	2,3-(OCF ₃) ₂	CF ₃	

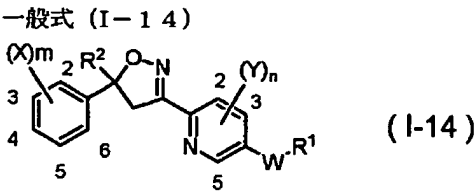
[0070] [表5]



第5表 (R²=CF₃)

No.	X ^m	Y ⁿ	W-R ¹	物性値
5-1	3,5-Cl ₂	H	CF ₃	1.5333 (23.0)
5-2	3,5-Cl ₂	2-Me	CF ₃	
5-3	3,5-Cl ₂	3-Me	CF ₃	
5-4	3,5-Cl ₂	5-Me	CF ₃	
5-5	3,5-Cl ₂	2-F	CF ₃	
5-6	3,5-Cl ₂	3-F	CF ₃	
5-7	3,5-Cl ₂	5-F	CF ₃	
5-8	3,5-Cl ₂	2-Cl	CF ₃	
5-9	3,5-Cl ₂	3-Cl	CF ₃	
5-10	3,5-Cl ₂	5-Cl	CF ₃	
5-11	3,5-Cl ₂	2-OMe	CF ₃	
5-12	3,5-Cl ₂	3-OMe	CF ₃	
5-13	3,5-Cl ₂	5-OMe	CF ₃	
5-14	3,5-Cl ₂	2-CF ₃	CF ₃	
5-15	3,5-Cl ₂	3-CF ₃	CF ₃	
5-16	3,5-Cl ₂	5-CF ₃	CF ₃	
5-17	3,5-Cl ₂	2-OCF ₃	CF ₃	
5-18	3,5-Cl ₂	3-OCF ₃	CF ₃	
5-19	3,5-Cl ₂	5-OCF ₃	CF ₃	

[0071] [表6-1]



第6表 (R²=CF₃)

No.	Xm	Yn	W	R1	物性値
6-1	3,5-Cl ₂	H	O	CF ₃	
6-2	3,5-Cl ₂	H	O	CHF ₂	
6-3	3,5-Cl ₂	H	O	CH ₂ CF ₃	
6-4	3,5-Cl ₂	H	O	CF ₂ CHF ₂	
6-5	3,5-Cl ₂	2-Me	O	CF ₃	
6-6	3,5-Cl ₂	3-Me	O	CF ₃	
6-7	3,5-Cl ₂	5-Me	O	CF ₃	
6-8	3,5-Cl ₂	2-F	O	CF ₃	
6-9	3,5-Cl ₂	3-F	O	CF ₃	
6-10	3,5-Cl ₂	5-F	O	CF ₃	
6-11	3,5-Cl ₂	2-Cl	O	CF ₃	
6-12	3,5-Cl ₂	3-Cl	O	CF ₃	
6-13	3,5-Cl ₂	5-Cl	O	CF ₃	
6-14	3,5-Cl ₂	2-OMe	O	CF ₃	
6-15	3,5-Cl ₂	3-OMe	O	CF ₃	
6-16	3,5-Cl ₂	5-OMe	O	CF ₃	
6-17	3,5-Cl ₂	2-CF ₃	O	CF ₃	
6-18	3,5-Cl ₂	3-CF ₃	O	CF ₃	
6-19	3,5-Cl ₂	5-CF ₃	O	CF ₃	
6-20	3,5-Cl ₂	2-OCF ₃	O	CF ₃	
6-21	3,5-Cl ₂	3-OCF ₃	O	CF ₃	
6-22	3,5-Cl ₂	5-OCF ₃	O	CF ₃	
6-23	3,5-Cl ₂	H	S	Me	
6-24	3,5-Cl ₂	H	S	CF ₃	
6-25	3,5-Cl ₂	H	S	CHF ₂	
6-26	3,5-Cl ₂	H	S	CH ₂ CF ₃	
6-27	3,5-Cl ₂	H	S	CF ₂ CHF ₂	

[0072] [表6-2]

WO 2007/125984

44

PCT/JP2007/059040

第6表 (続き)

No.	Xm	Yn	W	Ri	物性値
6-28	3,5-Cl ₂	2-Me	S	Me	
6-29	3,5-Cl ₂	3-Me	S	Me	
6-30	3,5-Cl ₂	5-Me	S	Me	
6-31	3,5-Cl ₂	2-F	S	Me	
6-32	3,5-Cl ₂	3-F	S	Me	
6-33	3,5-Cl ₂	5-F	S	Me	
6-34	3,5-Cl ₂	2-Cl	S	Me	
6-35	3,5-Cl ₂	3-Cl	S	Me	
6-36	3,5-Cl ₂	5-Cl	S	Me	
6-37	3,5-Cl ₂	2-OMe	S	Me	
6-38	3,5-Cl ₂	3-OMe	S	Me	
6-39	3,5-Cl ₂	5-OMe	S	Me	
6-40	3,5-Cl ₂	2-CF ₃	S	Me	
6-41	3,5-Cl ₂	3-CF ₃	S	Me	
6-42	3,5-Cl ₂	5-CF ₃	S	Me	
6-43	3,5-Cl ₂	2-OCF ₃	S	Me	
6-44	3,5-Cl ₂	3-OCF ₃	S	Me	
6-45	3,5-Cl ₂	5-OCF ₃	S	Me	
6-46	3,5-Cl ₂	H	SO	Me	
6-47	3,5-Cl ₂	H	SO	CF ₃	
6-48	3,5-Cl ₂	H	SO	CHF ₂	
6-49	3,5-Cl ₂	H	SO	CH ₂ CF ₃	
6-50	3,5-Cl ₂	H	SO	CF ₂ CHF ₂	
6-51	3,5-Cl ₂	2-Me	SO	Me	
6-52	3,5-Cl ₂	3-Me	SO	Me	
6-53	3,5-Cl ₂	5-Me	SO	Me	
6-54	3,5-Cl ₂	2-F	SO	Me	
6-55	3,5-Cl ₂	3-F	SO	Me	
6-56	3,5-Cl ₂	5-F	SO	Me	
6-57	3,5-Cl ₂	2-Cl	SO	Me	
6-58	3,5-Cl ₂	3-Cl	SO	Me	
6-59	3,5-Cl ₂	5-Cl	SO	Me	
6-60	3,5-Cl ₂	2-OMe	SO	Me	

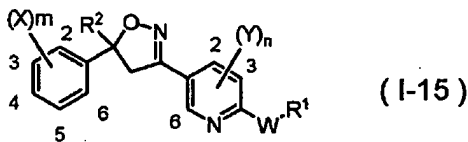
[0073] [表6-3]

第6表 (続き)

No.	Xm	Yn	W	R1	物性値
6-61	3,5-Cl ₂	3-OMe	SO	Me	
6-62	3,5-Cl ₂	5-OMe	SO	Me	
6-63	3,5-Cl ₂	2-CF ₃	SO	Me	
6-64	3,5-Cl ₂	3-CF ₃	SO	Me	
6-65	3,5-Cl ₂	5-CF ₃	SO	Me	
6-66	3,5-Cl ₂	2-OCF ₃	SO	Me	
6-67	3,5-Cl ₂	3-OCF ₃	SO	Me	
6-68	3,5-Cl ₂	5-OCF ₃	SO	Me	
6-69	3,5-Cl ₂	H	SO ₂	Me	
6-70	3,5-Cl ₂	H	SO ₂	CF ₃	
6-71	3,5-Cl ₂	H	SO ₂	CHF ₂	
6-72	3,5-Cl ₂	H	SO ₂	CH ₂ CF ₃	
6-73	3,5-Cl ₂	H	SO ₂	CF ₂ CHF ₂	
6-74	3,5-Cl ₂	2-Me	SO ₂	Me	
6-76	3,5-Cl ₂	3-Me	SO ₂	Me	
6-77	3,5-Cl ₂	5-Me	SO ₂	Me	
6-78	3,5-Cl ₂	2-F	SO ₂	Me	
6-79	3,5-Cl ₂	3-F	SO ₂	Me	
6-80	3,5-Cl ₂	5-F	SO ₂	Me	
6-81	3,5-Cl ₂	2-Cl	SO ₂	Me	
6-82	3,5-Cl ₂	3-Cl	SO ₂	Me	
6-83	3,5-Cl ₂	5-Cl	SO ₂	Me	
6-84	3,5-Cl ₂	2-OMe	SO ₂	Me	
6-85	3,5-Cl ₂	3-OMe	SO ₂	Me	
6-86	3,5-Cl ₂	5-OMe	SO ₂	Me	
6-87	3,5-Cl ₂	2-CF ₃	SO ₂	Me	
6-88	3,5-Cl ₂	3-CF ₃	SO ₂	Me	
6-89	3,5-Cl ₂	5-CF ₃	SO ₂	Me	
6-90	3,5-Cl ₂	2-OCF ₃	SO ₂	Me	
6-91	3,5-Cl ₂	3-OCF ₃	SO ₂	Me	
6-92	3,5-Cl ₂	5-OCF ₃	SO ₂	Me	

[0074] [表7]

一般式 (I-15)

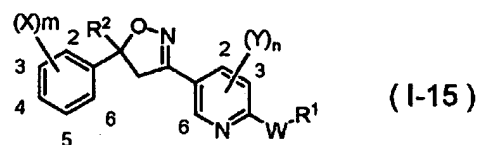


第7表 (R²=CF₃)

No.	Xm	Yn	W-R ¹	物性値
7-1	3,5-Cl ₂	H	CF ₃	
7-2	3,5-Cl ₂	2-Me	CF ₃	
7-3	3,5-Cl ₂	3-Me	CF ₃	
7-4	3,5-Cl ₂	6-Me	CF ₃	
7-5	3,5-Cl ₂	2-F	CF ₃	
7-6	3,5-Cl ₂	3-F	CF ₃	
7-7	3,5-Cl ₂	5-F	CF ₃	
7-8	3,5-Cl ₂	2-Cl	CF ₃	
7-9	3,5-Cl ₂	3-Cl	CF ₃	
7-10	3,5-Cl ₂	6-Cl	CF ₃	
7-11	3,5-Cl ₂	2-OMe	CF ₃	
7-12	3,5-Cl ₂	3-OMe	CF ₃	
7-13	3,5-Cl ₂	6-OMe	CF ₃	
7-14	3,5-Cl ₂	2-CF ₃	CF ₃	
7-15	3,5-Cl ₂	3-CF ₃	CF ₃	
7-16	3,5-Cl ₂	6-CF ₃	CF ₃	
7-17	3,5-Cl ₂	2-OCF ₃	CF ₃	
7-18	3,5-Cl ₂	3-OCF ₃	CF ₃	
7-19	3,5-Cl ₂	6-OCF ₃	CF ₃	

[0075] [表8-1]

一般式 (I-15)



第8表 ($R^2 = CF_3$)

No.	Xm	Yn	W	R ¹	物性値
8-1	3,5-Cl ₂	H	O	CF ₃	120-121
8-2	3,5-Cl ₂	H	O	CHF ₂	
8-3	3,5-Cl ₂	H	O	CH ₂ CF ₃	
8-4	3,5-Cl ₂	H	O	CF ₂ CHF ₂	
8-5	3,5-Cl ₂	2-Me	O	CF ₃	
8-6	3,5-Cl ₂	3-Me	O	CF ₃	
8-7	3,5-Cl ₂	6-Me	O	CF ₃	
8-8	3,5-Cl ₂	2-F	O	CF ₃	
8-9	3,5-Cl ₂	3-F	O	CF ₃	
8-10	3,5-Cl ₂	5-F	O	CF ₃	
8-11	3,5-Cl ₂	2-Cl	O	CF ₃	
8-12	3,5-Cl ₂	3-Cl	O	CF ₃	
8-13	3,5-Cl ₂	6-Cl	O	CF ₃	
8-14	3,5-Cl ₂	2-OMe	O	CF ₃	
8-15	3,5-Cl ₂	3-OMe	O	CF ₃	
8-16	3,5-Cl ₂	6-OMe	O	CF ₃	
8-17	3,5-Cl ₂	2-CF ₃	O	CF ₃	
8-18	3,5-Cl ₂	3-CF ₃	O	CF ₃	
8-19	3,5-Cl ₂	6-CF ₃	O	CF ₃	
8-20	3,5-Cl ₂	2-OCF ₃	O	CF ₃	
8-21	3,5-Cl ₂	3-OCF ₃	O	CF ₃	
8-22	3,5-Cl ₂	6-OCF ₃	O	CF ₃	109-110
8-23	3,5-Cl ₂	H	S	Me	
8-24	3,5-Cl ₂	H	S	CF ₃	
8-25	3,5-Cl ₂	H	S	CHF ₂	
8-26	3,5-Cl ₂	H	S	CH ₂ CF ₃	
8-27	3,5-Cl ₂	H	S	CF ₂ CHF ₂	

[0076] [表8-2]

WO 2007/125984

48

PCT/JP2007/059040

第8表 (続き)

No.	Xm	Yn	W	R ¹	物性値
8-28	3,5-Cl ₂	2-Me	S	Me	
8-29	3,5-Cl ₂	3-Me	S	Me	
8-30	3,5-Cl ₂	6-Me	S	Me	
8-31	3,5-Cl ₂	2-F	S	Me	
8-32	3,5-Cl ₂	3-F	S	Me	
8-33	3,5-Cl ₂	5-F	S	Me	
8-34	3,5-Cl ₂	2-Cl	S	Me	
8-35	3,5-Cl ₂	3-Cl	S	Me	
8-36	3,5-Cl ₂	5-Cl	S	Me	
8-37	3,5-Cl ₂	2-OMe	S	Me	
8-38	3,5-Cl ₂	3-OMe	S	Me	
8-39	3,5-Cl ₂	5-OMe	S	Me	
8-40	3,5-Cl ₂	2-CF ₃	S	Me	
8-41	3,5-Cl ₂	3-CF ₃	S	Me	
8-42	3,5-Cl ₂	5-CF ₃	S	Me	
8-43	3,5-Cl ₂	2-OCF ₃	S	Me	
8-44	3,5-Cl ₂	3-OCF ₃	S	Me	
8-45	3,5-Cl ₂	5-OCF ₃	S	Me	
8-46	3,5-Cl ₂	H	SO	Me	
8-47	3,5-Cl ₂	H	SO	CF ₃	
8-48	3,5-Cl ₂	H	SO	CHF ₂	
8-49	3,5-Cl ₂	H	SO	CH ₂ CF ₃	
8-50	3,5-Cl ₂	H	SO	CF ₂ CHF ₂	
8-51	3,5-Cl ₂	2-Me	SO	Me	
8-52	3,5-Cl ₂	3-Me	SO	Me	
8-53	3,5-Cl ₂	5-Me	SO	Me	
8-54	3,5-Cl ₂	2-F	SO	Me	
8-55	3,5-Cl ₂	3-F	SO	Me	
8-56	3,5-Cl ₂	5-F	SO	Me	
8-57	3,5-Cl ₂	2-Cl	SO	Me	
8-58	3,5-Cl ₂	3-Cl	SO	Me	
8-59	3,5-Cl ₂	5-Cl	SO	Me	
8-60	3,5-Cl ₂	2-OMe	SO	Me	

[0077] [表8-3]

第8表 (続き)

No.	X _m	Y _n	W	R'	物性値
8-61	3,5-Cl ₂	3-OMe	SO	Me	
8-62	3,5-Cl ₂	5-OMe	SO	Me	
8-63	3,5-Cl ₂	2-CF ₃	SO	Me	
8-64	3,5-Cl ₂	3-CF ₃	SO	Me	
8-65	3,5-Cl ₂	5-CF ₃	SO	Me	
8-66	3,5-Cl ₂	2-OCF ₃	SO	Me	
8-67	3,5-Cl ₂	3-OCF ₃	SO	Me	
8-68	3,5-Cl ₂	5-OCF ₃	SO	Me	
8-69	3,5-Cl ₂	H	SO ₂	Me	
8-70	3,5-Cl ₂	H	SO ₂	CF ₃	
8-71	3,5-Cl ₂	H	SO ₂	CHF ₂	
8-72	3,5-Cl ₂	H	SO ₂	CH ₂ CF ₃	
8-73	3,5-Cl ₂	H	SO ₂	CF ₂ CHF ₂	
8-74	3,5-Cl ₂	2-Me	SO ₂	Me	
8-76	3,5-Cl ₂	3-Me	SO ₂	Me	
8-77	3,5-Cl ₂	5-Me	SO ₂	Me	
8-78	3,5-Cl ₂	2-F	SO ₂	Me	
8-79	3,5-Cl ₂	3-F	SO ₂	Me	
8-80	3,5-Cl ₂	5-F	SO ₂	Me	
8-81	3,5-Cl ₂	2-Cl	SO ₂	Me	
8-82	3,5-Cl ₂	3-Cl	SO ₂	Me	
8-83	3,5-Cl ₂	5-Cl	SO ₂	Me	
8-84	3,5-Cl ₂	2-OMe	SO ₂	Me	
8-85	3,5-Cl ₂	3-OMe	SO ₂	Me	
8-86	3,5-Cl ₂	5-OMe	SO ₂	Me	
8-87	3,5-Cl ₂	2-CF ₃	SO ₂	Me	
8-88	3,5-Cl ₂	3-CF ₃	SO ₂	Me	
8-89	3,5-Cl ₂	5-CF ₃	SO ₂	Me	
8-90	3,5-Cl ₂	2-OCF ₃	SO ₂	Me	
8-91	3,5-Cl ₂	3-OCF ₃	SO ₂	Me	
8-92	3,5-Cl ₂	5-OCF ₃	SO ₂	Me	

[0078] [表9]

WO 2007/125984

50

PCT/JP2007/059040

第9表

化合物No.	¹ H-NMR(CDCl ₃ /TMS, δ 値ppm)
2-9	7.58(1H,d), 7.51(2H,s), 7.50(1H,dd), 7.42(1H,t), 5.95(1H,tt), 4.07(1H,d), 3.69(1H,d), 2.31(3H,s)
2-18	7.78(1H, d), 7.75(1H, d), 7.69(1H, dt), 7.54(1H, m), 7.47(1H, m), 7.06(1H, t), 4.12(1H, d), 3.75(1H, d), 2.79(3H, d), 3.08(3H, s)
2-20	8.48(1H, d), 8.04(1H, d), 7.49-7.60(3H, m), 7.43(1H, t), 7.17(1H, dd), 7.08(1H, d), 6.12(1H, t), 4.23(2H, d), 4.05(1H, d), 3.67(1H, d), 2.71(3H, s)
2-22	8.55(1H, s), 7.62(1H, dt), 7.50(2H, d), 7.43(1H, d), 7.35-40(3H, m), 7.29(1H, t), 7.17(1H, dd), 4.30(2H, s), 4.04(1H, d), 3.66(1H, d), 2.34(3H, s)
2-29	9.02(1H, d), 7.94(1H, dd), 1.82(1H, m), 7.51(2H, d), 7.44(1H, t), 4.09(1H, d), 3.71(1H, d), 2.84(3H, d)
2-49	8.00(1H, d), 7.41-7.48(6H, m), 7.23(2H, dd), 7.05(2H, d), 4.02(1H, dd), 3.63(1H, dd), 2.90(3H, d)
2-53	7.89(1H, d), 7.51(2H, d), 7.44(1H, d), 7.44(1H, dd), 7.26(1H, dd), 4.11(1H, dd), 3.96(3H, s), 3.73(1H, dd), 2.80(3H, d)

[0079] 本発明の一般式(I)で表されるイソキサゾリン誘導体を有効成分として含有する有害生物防除剤、特に農園芸用殺虫剤は水稻、果樹、野菜、その他の作物及び花卉類を加害する各種農林、園芸、貯穀害虫や衛生害虫或いは線虫等の害虫防除に適しており、例えばリンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana fasciata*)、チャノコカクモンハマキ (*Adoxophyes* sp.)、リンゴコシンクイ (*Grapholita inopinata*)、ナシヒメシンクイ (*Grapholita molesta*)、マメシンクイガ (*Leguminivora glycinivorella*)、クワハマキ (*Oletreutes mori*)、チャノホソガ (*Caloptilia theivora*)、リンゴホソガ (*Caloptilia zachrysa*)、キンモンホソガ (*Phyllonorycter ringoniella*)、ナシホソガ (*Spulerina astaurola*)、モンシロチョウ (*Pieris rapae crucivora*)、オオタバコガ類 (*Heliothis* sp.)、コドリング (*Laspheyresia pomonella*)、コナガ (*Plutella xylostella*)、リンゴヒメシンクイ (*Argyresthia conjugella*)、モモシンクイガ (*Carposina niponensis*)、ニカメイガ (*Chilo suppressalis*)、コブノメイガ (*Cnaphalocrocis medinalis*)、チャマダラメイガ (*Ephestia elutelia*)、クワノメイガ (*Glyphodes pyloalis*)、サンカメイガ (*Scirpophaga incertulas*)、イチモンジセセリ (*Parnara guttata*)、アワヨトウ (*Pseudaletia separata*)、

[0080] イネヨトウ (*Sesamia inferens*)、ハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*)、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera egigua*) 等の鱗翅目害虫、フタテンヨコバイ (*Macrosteles fascifrons*)、ツマグロヨコバイ (*Nephotettix cincticeps*)、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*)、セジロウン

カ (*Sogatella furcifera*)、ミカンキジラミ (*Diaphorina citri*)、ブドウコナジラミ (*Aleurolobus taenabae*)、タバココナジラミ (*Bemisia tabaci*)、オンシツコナジラミ (*Trialeurodes vaporariorum*)、ニセダイコンアブラムシ (*Lipaphis erysimi*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)、ツノロウムシ (*Ceroplastes ceriferus*)、ミカンワタカイガラムシ (*Pulvinaria aurantii*)、ミカンマルカイガラムシ (*Pseudaonidia duplex*)、ナシマルカイガラムシ (*Comstockaspis perniciosus*)、ヤノネカイガラムシ (*Unaspis yanonensis*)等の半翅目害虫、ネグサレセンチュウ (*Pratylenchus* sp.)、ヒメコガネ (*Anomala rufocuprea*)、マメコガネ (*Popilla japonica*)、タバコシバンムシ (*Lasioderma serricornis*)、

[0081] ヒラタキクイムシ (*Lyctus brunneus*)、ニジュウヤホシテントウ (*Epilachna vigintioctopunctata*)、アズキゾウムシ (*Callosobruchus chinensis*)、ヤサイゾウムシ (*Listroderes costirostris*)、コクゾウムシ (*Sitophilus zeamais*)、ワタミゾウムシ (*Anthonomus grandis grandis*)、イネミズゾウムシ (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、ウリハムシ (*Aulacophora femoralis*)、イネドロオイムシ (*Oulema oryzae*)、キスジノミハムシ (*Phyllotreta striolata*)、マツノキクイムシ (*Tomicus piniperda*)、コロラドポテトビートル (*Leptinotarsa decemlineata*)、メキシカンビーンビートル (*Epilachna varivestis*)、コーンルーツワーム類 (*Diabrotica* sp.)等の甲虫目害虫、ウリミバエ (*Dacus* (*Zeugodacus*) *cucurbitae*)、ミカンコミバエ (*Dacus* (*Bactrocera*) *dorsalis*)、イネハモグリバエ (*Agromyza oryzae*)、タマネギバエ (*Delia antiqua*)、タネバエ (*Dalia platura*)、ダイズサヤタマバエ (*Asphondylia* sp.)、イエバエ (*Musca domestica*)、アカイエカ (*Culex pipiens pipiens*)等の双翅目害虫、ミナミネグサレセンチュウ (*Pratylenchus coffeae*)、ジャガイモシストセンチュウ (*Glabodera rostchiansis*)、

[0082] ネコブセンチュウ (*Meloidogyne* sp.)、ミカンネセンチュウ (*Tylenchulus semipenetrans*)、ニセネグサレセンチュウ (*Aphelenchus avenae*)、ハガレセンチュウ (*Aphelenchoides ritzemabosi*)等のハリセンチュウ目害虫、ミカンハダニ (*Panonychus citri*)、リンゴハダニ (*Panonychus ulmi*)、ニセナミハダニ (*Tetranychus cinnabarinus*)、カンザワハダニ (*Tetranychus kanzawai* Kishida)、ナミハダニ (*Tetranychus urticae* Koch)、チャノナガサビダニ (*Acaphylla theae*)、ミカンサビハダニ (*Aculops pelekassi*)、チャノサビダニ (*Calacarus carinatus*)、ナシサビダニ (*Epitrimerus pyri*)等のダニ目害虫に対して

WO 2007/125984

52

PCT/JP2007/059040

強い殺虫効果を有するものである。

また、ミゾガシラシロアリ科 (Rhinotermitidae) のイエシロアリ (*Coptotermes formosanus* Shiraki)、ヤマトシロアリ (*Reticulitermes speratus* (Kolbe))、北アメリカに生息する *Reticulitermes hesperus*、*Reticulitermes tibialis*、*Reticulitermes flavipes* 等、地中海沿岸に生息する *Reticulitermes lucifugus*、*Reticulitermes santonensis* 等、アメリカカンザイシロアリ (*Incisitermes minor* (Hagen)) やシロアリ科 (termitidae) のタイワンシロアリ (*Odontotermes formosanus* (Shiraki))、レイビシロアリ科 (Kalotermitidae) のダイコクシロアリ (*Cryptotermes domesticus* (Haviland)) 及びオオシロアリ科 (Termopsidae) の *Odontotermes japonica* (Holmgren) 等の家屋、建材類、家具類、皮革類、繊維類、ビニール加工品、電線・ケーブル等に加害する全ての白蟻類に対して低薬量で顕著な殺蟻効果を有するものである。又、アリ科 (Formicidae) のイエヒメアリ (*Monomorium pharaoni* Linnes)、ヒメアリ (*Monomorium nipponense* Wheeler)、ミカドオオアリ (*Camponotus kiusiuensis* Santschi)、クロヤマアリ (*Formica japonica* Motschulsky)、クロクサアリ (*Lasius fuliginosus* (Latreille)) 等や北アメリカに生息するファイヤーアント (*Solenopsis richteri*、*Solenopsis invicta*、*Solenopsis geminata* (F)) 等の農作物又は公園等の公共施設や家屋に侵入し、人に加害する蟻類に対しても低薬量で顕著な殺蟻効果を有するものである。

[0083] 更に、本発明の一般式(I)で表されるイソキサゾリン誘導体は、牛、馬、羊等の家畜、犬、猫等のペットの他、マウス、ラット、ハムスター、リス等のげっ歯目動物、ウサギ目動物、フェレット等の食肉目動物、アヒル、ニワトリ、ハト等の鳥類の外部寄生虫に対しても使用でき、例えばネコノミ (*Ctenocephalides felis*)、イヌノミ (*Ctenocephalides canis*)、ケオプスネズミノミ (*Xenopsylla cheopis*) 等のノミ目害虫、フタトゲチマダニ (*Haemaphysalis longicornis*)、オウシマダニ (*Boophilus microplus*) 等のダニ目害虫、ウシジラミ (*Haematopinus eurysternus*)、ヒツジジラミ (*Damalinia ovis*) 等のシラミ目害虫等の外部寄生虫に対しても強い殺虫効果を有するものである。

[0084] 本発明の一般式(I)で表されるイソキサゾリン誘導体を有効成分とする有害生物防除剤、特に農園芸用殺虫剤は、水田作物、畑作物、果樹、野菜、その他の作物及び花卉等に被害を与える前記害虫に対して顕著な防除効果を有するので、害虫の発

生が予測される時期に合わせて、害虫の発生前又は発生が確認された時点で育苗施設、水田、畑、果樹、野菜、その他の作物、花卉等の種子、水田水、茎葉又は土壌等の栽培担体等に処理することにより本発明の農園芸用殺虫剤の所期の効果が奏せられるものである。中でも、作物、花卉等の育苗土壌、移植時の植え穴土壌、株元、灌漑水、水耕栽培における栽培水等に処理して、土壌を介し又は介さずして根から本発明化合物を吸収させることによるいわゆる浸透移行性を利用した施用が好ましい使用形態である。また、近年、遺伝子組み換え作物(除草剤耐性作物、殺虫性タンパク産生遺伝子を組み込んだ害虫耐性作物、病害に対する抵抗性誘導物質産生遺伝子を組み込んだ病害耐性作物、食味向上作物、保存性向上作物、収量向上作物など)、昆虫性フェロモン(ハマキガ類、ヨトウガ類の交信攪乱剤など)、天敵昆虫などを用いたIPM(総合的害虫管理)技術が進歩しており、本発明の有害生物防除剤、特に農園芸用殺虫剤はそれらの技術と併用、あるいは体系化して用いることができる。

[0085] 本発明の有害生物防除剤、特に農園芸用殺虫剤を使用できる植物は特に限定されるものではないが、例えば以下に示した植物が挙げられる。

穀類(例えば、稲、大麦、小麦、ライ麦、オート麦、トウモロコシ等)、豆類(大豆、小豆、そら豆、えんどう豆、インゲン豆、落花生等)、果樹・果実類(林檎、柑橘類、梨、葡萄、桃、梅、黄桃、胡桃、栗、アーモンド、バナナ、イチゴ等)、葉・果菜類(キャベツ、トマト、ホウレンソウ、ブロッコリー、レタス、タマネギ、ネギ、ピーマン、ナス、ペッパー等)、根菜類(ニンジン、馬鈴薯、サツマイモ、サトイモ、大根、蓮根、カブ、ゴボウ、ニンニク等)、加工用作物(棉、麻、ビート、ホップ、サトウキビ、テンサイ、オリーブ、ゴム、コーヒー、タバコ、茶等)、ウリ類(カボチャ、キュウリ、マクワウリ、スイカ、メロン等)、牧草類(オーチャードグラス、ソルガム、チモシー、クローバー、アルファルファ等)、芝類(高麗芝、ベントグラス等)、香料等鑑賞用作物(ラベンダー、ローズマリー、タイム、パセリ、胡椒、生姜等)、花卉類(キク、バラ、カーネーション、蘭等)、庭木(イチョウ、サクラ類、アオキ等)、林木(トドマツ類、エゾマツ類、松類、ヒバ、杉、桧等)等の植物に使用できる。

[0086] 本発明の有害生物防除剤、特に農園芸用殺虫剤は各種害虫を防除するためにそ

WO 2007/125984

54

PCT/JP2007/059040

のまま、又は水等で適宜希釈し、若しくは懸濁させた形で害虫あるいは線虫防除に有効な量を当該害虫および線虫の発生が予測される植物に使用すればよく、例えば果樹、穀類、野菜等において発生する害虫および線虫に対しては茎葉部に散布する他に、種子の薬剤への浸漬、種子粉衣、カルパー処理等の種子処理、土壌全層混和、作条施用、床土混和、セル苗処理、植え穴処理、株元処理、トップドレス、イネの箱処理、水面施用等、土壌等に処理して根から吸収させて使用することもできる。加えて、養液(水耕)栽培における養液への施用、くん煙あるいは樹幹注入等による使用もできる。

更に、本発明の有害生物防除剤、特に農園芸用殺虫剤は、そのまま、又は水等で適宜希釈し、若しくは懸濁させた形で害虫防除に有効な量を当該害虫の発生が予測される場所に使用すればよく、例えば貯穀害虫、家屋害虫、衛生害虫、森林害虫等に散布する他に、家屋建材への塗布、くん煙、ベイト等として使用することもできる。

[0087] 種子処理の方法としては、例えば、液状又は固体状の製剤を希釈又は希釈せずして液体状態にて種子を浸漬して薬剤を浸透させる方法、固形製剤又は液状製剤を種子と混和、粉衣処理して種子の表面に付着させる方法、樹脂、ポリマー等の付着性の担体と混和して種子にコーティングする方法、植え付けと同時に種子付近に散布する方法等が挙げられる。

当該種子処理を行う「種子」とは、植物の繁殖に用いられる栽培初期の植物体を意味し、例えば、種子の他、球根、塊茎、種芋、株芽、むかご、鱗茎、あるいは挿し木栽培用の栄養繁殖用の植物体を挙げることができる。

本発明の使用方法を実施する場合の植物の「土壌」又は「栽培担体」とは、作物を栽培するための支持体、特に根を生えさせる支持体を示すものであり、材質は特に制限されないが、植物が生育しうる材質であれば良く、いわゆる土壌、育苗マット、水等であっても良く、具体的な素材としては例えば、砂、軽石、バーミキュライト、珪藻土、寒天、ゲル状物質、高分子物質、ロックウール、グラスウール、木材チップ、バーク等であっても良い。

[0088] 作物茎葉部又は貯穀害虫、家屋害虫、衛生害虫若しくは森林害虫等への散布方

法としては、乳剤、フロアブル剤等の液体製剤又は水和剤もしくは顆粒水和剤等の固形製剤を水で適宜希釈し、散布する方法、粉剤を散布する方法、又はくん煙等が挙げられる。

土壌への施用方法としては、例えば、液体製剤を水に希釈又は希釈せずして植物体の株元または育苗用苗床等に施用する方法、粒剤を植物体の株元又は育苗のための苗床等に散布する方法、播種前または移植前に粉剤、水和剤、顆粒水和剤、粒剤等を散布し土壌全体と混和する方法、播種前または植物体を植える前に植え穴、作条等に粉剤、水和剤、顆粒水和剤、粒剤等を散布する方法等が挙げられる。

[0089] 水稻の育苗箱への施用方法としては、剤型は、例えば播種時施用、緑化期施用、移植時施用などの施用時期により異なる場合もあるが、粉剤、顆粒水和剤、粒剤等の剤型で施用すればよい。培土との混和によっても施用することができ、培土と粉剤、顆粒水和剤又は粒剤等との混和、例えば、床土混和、覆土混和、培土全体への混和等することができる。単に、培土と各種製剤を交互に層状にして施用してもよい。

水田への施用方法としては、ジャンボ剤、パック剤、粒剤、顆粒水和剤等の固形製剤、フロアブル、乳剤等の液体状製剤を、通常は、湛水状態の水田に散布する。その他、田植え時には、適当な製剤をそのまま、あるいは、肥料に混和して土壌に散布、注入することもできる。また、水口や灌漑装置等の水田への水の流入元に乳剤、フロアブル等の薬液を利用することにより、水の供給に伴い省力的に施用することもできる。

[0090] 畑作物においては、播種から育苗期において、種子又は植物体に近接する栽培担体等へ処理ができる。畑に直接播種する植物においては、種子への直接処理の他、栽培中の植物の株元への処理が好適である。粒剤を用いて散布処理又は水に希釈あるいは希釈しない薬剤を液状にて灌注処理を行うこと等ができる。粒剤を播種前の栽培担体と混和させた後、播種するのも好ましい処理である。

移植を行う栽培植物の播種、育苗期の処理としては、種子への直接処理の他、育苗用苗床への、液状とした薬剤の灌注処理又は粒剤の散布処理が好ましい。また、定植時に粒剤を植え穴に処理したり、移植場所近辺の栽培担体に混和することも好ましい処理である。

WO 2007/125984

56

PCT/JP2007/059040

本発明の農園芸用殺虫剤は、農薬製剤上の常法に従い使用上都合の良い形状に製剤して使用するのが一般的である。

即ち、一般式(I)で表される光学活性フタルアミド誘導体はこれらを適当な不活性担体に、又は必要に応じて補助剤と一緒に適当な割合に配合して溶解、分離、懸濁、混合、含浸、吸着若しくは付着させて適宜の剤型、例えば懸濁剤、乳剤、液剤、水和剤、顆粒水和剤、粒剤、粉剤、錠剤、パック剤等に製剤して使用すれば良い。

[0091] 本発明で使用できる不活性担体としては固体又は液体の何れであっても良く、固体の担体になりうる材料としては、例えばダイズ粉、穀物粉、木粉、樹皮粉、鋸粉、タバコ茎粉、クルミ殻粉、ふすま、繊維素粉末、植物エキス抽出後の残渣、粉碎合成樹脂等の合成重合体、粘土類(例えばカオリン、ベントナイト、酸性白土等)、タルク類(例えばタルク、ピロフィライト等)、シリカ類(例えば珪藻土、珪砂、雲母、ホワイトカーボン(含水微粉珪素、含水珪酸ともいわれる合成高分散珪酸で、製品により珪酸カルシウムを主成分として含むものもある。)、活性炭、イオウ粉末、軽石、焼成珪藻土、レンガ粉碎物、フライアッシュ、砂、炭酸カルシウム、磷酸カルシウム等の無機鉱物性粉末、ポリエチレン、ポリプロピレン、ポリ塩化ビニリデン等のプラスチック担体、硫酸、燐安、硝安、尿素、塩安等の化学肥料、堆肥等を挙げることができ、これらは単独で若しくは二種以上の混合物の形で使用される。

[0092] 液体の担体になりうる材料としては、それ自体溶媒能を有するものの他、溶媒能を有さずとも補助剤の助けにより有効成分化合物を分散させうるものから選択され、例えば代表例として次に挙げる担体を例示できる。これらは単独で若しくは2種以上の混合物の形で使用され、例えば水、アルコール類(例えばメタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、エチレングリコール等)、ケトン類(例えばアセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、ジイソブチルケトン、シクロヘキサノン等)、エーテル類(例えばエチルエーテル、ジオキサン、セロソルブ、ジプロピルエーテル、テトラヒドロフラン等)、脂肪族炭化水素類(例えばケロシン、鉱油等)、芳香族炭化水素類(例えばベンゼン、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、アルキルナフタレン等)、ハロゲン化炭化水素類(例えばジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素、塩素化ベンゼン等)、エステル類(例えば酢酸エチル、ジイソブチルフタレート、ジ

ブチルフタレート、ジオクチルフタレート等)、アミド類(例えばジメチルホルムアミド、ジエチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等)、ニトリル類(例えばアセトニトリル等)、ジメチルスルホキシド類等を挙げることができる。

[0093] 補助剤として代表的なものを次に例示するが、これらの補助剤は目的に応じて使用され、単独で、ある場合は二種以上の補助剤を併用し、又ある場合には全く補助剤を使用しないことも可能である。

有効成分化合物の乳化、分散、可溶化及び／又は湿潤の目的で、例えばポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレン高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン樹脂酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタンモノラウレート、ポリオキシエチレンソルビタンモノオレエート、アルキルアリールスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸縮合物、リグニンスルホン酸塩、高級アルコール硫酸エステル等の界面活性剤を使用することができる。

有効成分化合物の分散安定化、粘着及び／又は結合の目的で、例えばカゼイン、ゼラチン、澱粉、メチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、アラビアゴム、ポリビニルアルコール、松根油、糠油、ベントナイト、リグニンスルホン酸塩等を使用することができる。固体製品の流動性改良の目的で、例えばワックス、ステアリン酸塩、燐酸アルキルエステル等を使用することができる。

[0094] 又、懸濁性製品の解こう剤として、例えばナフタレンスルホン酸縮合物、縮合燐酸塩等を、消泡剤として、例えばシリコーン油等を、防腐剤として、1, 2-ベンズイソチアゾリン-3-オン、パラクロロメタキシレノール、パラオキシ安息香酸ブチル等を使用することができる。

更に必要に応じて機能性展着剤、ピペロニルブトキサイド等の代謝分解阻害剤等の活性増強剤、プロピレングリコール等の凍結防止剤、BHT等の酸化防止剤、紫外線吸収剤等その他の補助剤も使用することができる。

有効成分化合物の配合割合は必要に応じて加減することができ、有害生物防除剤、特に農園芸用殺虫剤100重量部中、0.01～90重量部の範囲から適宜選択して使用すれば良く、例えば、粉剤、粒剤、乳剤又は水和剤とする場合は0.01～50重量%が適当である。

WO 2007/125984

58

PCT/JP2007/059040

[0095] 本発明の有害生物防除剤、特に農園芸用殺虫剤の使用量は種々の因子、例えば目的、対象害虫、作物の生育状況、害虫の発生傾向、天候、環境条件、剤型、施用方法、施用場所、施用時期等により変動するが、有効成分化合物として10アール当たり0.001g～10kg、好ましくは0.01g～1kgの範囲から目的に応じて適宜選択すれば良い。

本発明の有害生物防除剤、特に農園芸用殺虫剤は、更に防除対象病虫害、防除適期の拡大のため、或いは薬量の低減をはかる目的で他の農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、生物農薬等と混合して使用することも可能であり、又、使用場面に応じて除草剤、植物成長調節剤、肥料等と混合して使用することも可能である。

かかる目的で使用する他の農園芸殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤としては、例えばエチオン、トリクロルホン、メタミドホス、アセフェート、ジクロルボス、メビンホス、モノクロトホス、マラチオン、ジメトエート、ホルモチオン、メカルバム、バミドチオン、チオメトン、ジスルホトン、オキシデプロホス、ナレド、メチルパラチオン、フェントロチオン、シアノホス、プロパホス、

[0096] フェンチオン、プロチオホス、プロフェノホス、イソフェンホス、テメホス、フェントエート、ジメチルビンホス、クロルフエビンホス、テトラクロルビンホス、ホキシム、イソキサチオン、ピラクロホス、メチダチオン、クロロピリホス、クロルピリホス・メチル、ピリダフェンチオン、ダイアジノン、ピリミホスメチル、ホサロン、ホスメット、ジオキサベンゾホス、キナルホス、テルブホス、エトプロホス、カズサホス、メスルフェンホス、DPS (NK-0795)、ホスホカルブ、フェナミホス、イソアミドホス、ホスチアゼート、イサゾホス、エナプロホス、フェンチオン、ホスチエタン、ジクロフェンチオン、チオナジン、スルプロホス、フェンスルフォチオン、ジアミダホス、ピレトリン、アレスリン、プラレトリン、レスメトリン、ペルメトリン、テフルトリン、ピフェントリン、フェンプロパトリン、シペルメトリン、アルファシペルメトリン、シハロトリン、ラムダ・シハロトリン、デルタメトリン、アクリナトリン、

[0097] フェンバレレート、エスフェンバレレート、シクロプロトリン、エトフェンプロックス、ハルフェンプロックス、シラフルオフエン、フルシトリネート、フルバリネート、メソミル、オキサミル、チオジカルブ、アルジカルブ、アラニカルブ、カルタップ、メトルカルブ、キシリカ

ルブ、プロポキスル、フェノキシカルブ、フェノブカルブ、エチオフェンカルブ、フェノチオカルブ、ビフェナゼート、フェノブカルブ、カルバリル、ピリミカーブ、カルボフラン、カルボスルファン、フラチオカルブ、ベンフラカルブ、アルドキシカルブ、ジアフェンチウロン、ジフルベンズロン、テフルベンズロン、ヘキサフルムロン、ノバルロン、ルフェヌロン、フルフェノクスロン、クロルフルアズロン、酸化フェンブタスズ、水酸化トリシクロヘキシルスズ、オレイン酸ナトリウム、オレイン酸カリウム、メブレン、ハイドロブレン、ビナパクリル、アミラズ、ジコホル、ケルセン、クロルベンジレート、フェニソプロモレート、テトラジホン、ベンスルタップ、ベンゾメート、テブフェノジド、メキシフェノジド、ピリダリル、

[0098] クロマフェノジド、プロパルギット、アセキノシル、エンドスルファン、ジオフェノラン、クロルフェナピル、フェンピロキシメート、トルフェンピラド、フィプロニル、テブフェンピラド、トリアザメート、エトキサゾール、ヘキシチアゾクス、硫酸ニコチン、ニテンピラム、アセタミプリド、チアクロプリド、イミダクロプリド、チアメトキサム、クロチアニジン、ジノテフラン、フルアジナム、ピリプロキシフェン、ヒドラメチルノン、ピリミジフェン、ピリダベン、シロマジン、TPIC (トリプロピルイソシアヌレート)、ピメロジン、クロフェンテジン、ブプロフェジン、チオシクラム、フェナザキン、キノメチオネート、インドキサカルブ、ポリナクチン複合体、ミルベメクチン、アバメクチン、エマメクチン・ベンゾエート、スピノサッド、BT (バチルス・チューリンゲンシス)、アザディラクチン、ロテノン、ヒドロキシプロピルデンブ、塩酸レバミゾール、メタム・ナトリウム、酒石酸モランテル、ダゾメット、トリクラミド、パストリア、モナクロスポリウム・フィマトパガム等の農園芸殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤を例示することができ、

[0099] 同様の目的で使用する農園芸用殺菌剤としては、例えば硫黄、石灰硫黄合剤、塩基性硫酸銅、イプロベンホス、エディフェンホス、トルクロホス・メチル、チラム、ポリカーバメイト、ジネブ、マンゼブ、マンコゼブ、プロピネブ、チオフアネート、チオフアネートメチル、ベノミル、イミノクタジン酢酸塩、イミノクタジンアルベシル酸塩、メプロニル、フルトラニル、ペンシクロン、フラメトピル、チフルザミド、メタラキシル、オキサジキシル、カルプロパミド、ジクロフルアニド、フルスルファミド、クロロタロニル、クレソキシムメチル、フェノキサニル、ヒメキサゾール、エクロメゾール、フルオルイミド、プロシミドン、ビ

WO 2007/125984

60

PCT/JP2007/059040

ンクロゾリン、イプロジオン、トリアジメホン、トリフルミゾール、ビテルタノール、トリフルミゾール、イブコナゾール、フルコナゾール、プロピコナゾール、ジフェノコナゾール、ミクロブタニル、テトラコナゾール、ヘキサコナゾール、テブコナゾール、イミベンコナゾール、プロクロラズ、ペフラゾエート、シプロコナゾール、イソプロチオラン、フェナリモル、ピリメタニル、メパニピリム、ピリフェノックス、フルアジナム、トリホリン、ジクロメジン、アゾキシストロビン、トリフロキシストロビン、オリサストロビン、チアジアジン、キャプタン、チアジニル、プロベナゾール、アシベンゾフラールSメチル (CGA-245704)、フサライド、トリシクラゾール、ピロキロン、キノメチオネート、オキシソリニック酸、ジチアノン、シアゾファミド、チアジニル、ジクロシメット、カスガマイシン、バリダマイシン、ポリオキシシン、ブラストサイジン、ストレプトマイシン等の農園芸用殺菌剤を例示することができる、

[0100] 同様に除草剤としては、例えばグリホサート、スルホセート、グルホシネート、ビアラホス、ブタミホス、エスプロカルブ、プロスルホカルブ、ベンチオカーブ、ピリブチカルブ、アシュラム、リニュロン、ダイムロン、イソウロン、ベンスルフロンメチル、シクロスルファムロン、シノスルフロン、ピラゾスルフロンエチル、アジムスルフロン、イマゾスルフロン、テニルクロール、アラクロール、プレチラクロール、クロメプロップ、エトベンザニド、メフェナセット、フルフェナセット、フェントラザミド、ペンディメタリン、ビフェノックス、アシフルオフエン、ラクトフェン、シハロホップブチル、アイオキシニル、プロモブチド、アロキシジム、セトキシジム、ナプロパミド、インダノファン、ピラゾレート、ベンゾフェナップ、ピラフルフェンエチル、イマザピル、スルフエントラゾン、カフェンストロール、ベントキサゾン、オキサゾアゾン、パラコート、ジクワット、ピリミノバック、シマジン、アトラジン、ジメタメリン、トリアジフラム、ベンフレセート、フルチアセットメチル、キザロホップエチル、ベンタゾン、オキサジクロメホン、アザフェニジン、ベンゾビシクロン、過酸化カルシウム等の除草剤を例示することができる。

[0101] 又、生物農薬として、例えば核多角体ウイルス (Nuclear polyhedrosis virus、NPV)、顆粒病ウイルス (Granulosis virus、GV)、細胞質多角体病ウイルス (Cytoplasmic polyhedrosis virus、CPV)、昆虫ボックスウイルス (Entomopox virus、EPV) 等のウイルス製剤、モノクロスポリウム・フィマトパガム (Monacrosporium phymatophagum)、スタイナ

WO 2007/125984

61

PCT/JP2007/059040

ーネマ・カーポカプサエ (*Steinernema carpocapsae*)、スタイナーネマ・クシダエ (*Steinernema kushidai*)、パスツーリア・ペネトランス (*Pasteuria penetrans*) 等の殺虫又は殺線虫剤として利用される微生物農薬、トリコデルマ・リグノラン (*Trichoderma lignorum*)、アグロバクテリウム・ラジオブクター (*Agrobacterium radiobacter*)、非病原性エルビニア・カロトボーラ (*Erwinia carotovora*)、バチルス・ズブチリス (*Bacillus subtilis*) 等の殺菌剤として使用される微生物農薬、ザントモナス・キャンペストリス (*Xanthomonas campestris*) 等の除草剤として利用される生物農薬などと混合して使用することにより、同様の効果が期待できる。

- [0102] 更に、生物農薬として例えばオンシツツヤコバチ (*Encarsia formosa*)、コレマンアブラバチ (*Aphidius colemani*)、シヨクガタマバエ (*Aphidoletes aphidimyza*)、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*)、ハモグリコマユバチ (*Dacnusa sibirica*)、チリカブリダニ (*Phytoseiulus persimilis*)、ククメリスカブリダニ (*Amblyseius cucumeris*)、ナミヒメハナカメムシ (*Orius sauteri*) 等の天敵生物、ボーベリア・ブロンニアティ (*Beauveria brongniartii*) 等の微生物農薬、(Z)-10-テトラデセニル=アセタート、(E, Z)-4, 10-テトラデカジニエル=アセタート、(Z)-8-ドデセニル=アセタート、(Z)-11-テトラデセニル=アセタート、(Z)-13-イコセン-10-オン、(Z)-13-イコセン-10-オン、14-メチル-1-オクタデセン等のフェロモン剤と併用することも可能である。

実施例

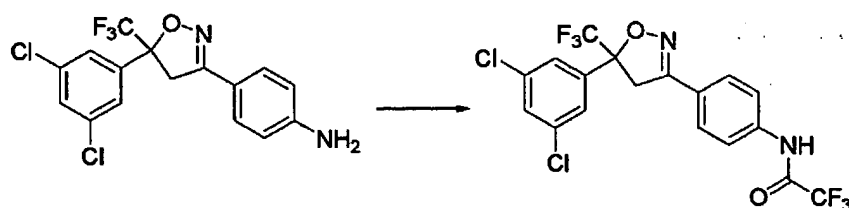
- [0103] 以下に本発明の代表的な実施例を例示するが、本発明はこれらに限定されるものではない。

実施例1. N-{4-[5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-2-イソキサゾリン-3-イル]フェニル}トリフルオロ酢酸アミド(化合物No. 1-1)の製造
[化12]

WO 2007/125984

62

PCT/JP2007/059040



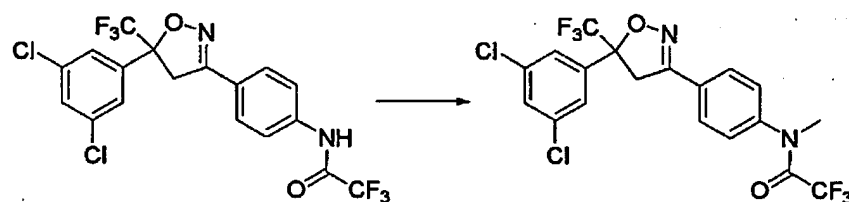
4-[5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-2-イソキサゾリン-3-イル]アニリン0. 23g (0. 6ミリモル)のテトラヒドロフラン5ml溶液に、ピリジン0. 06g (0. 8ミリモル)を加え、氷水冷下、トリフルオロ酢酸無水物0. 15g (0. 7ミリモル)を滴下した。室温に戻し、12時間攪拌した後、反応溶液を氷水中に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製して、目的物0. 22gを得た。

収率: 74%

物性: 屈折率 1. 5222 (22. 0°C)

[0104] 実施例2. N-メチル-N-{4-[5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-2-イソキサゾリン-3-イル]フェニル}トリフルオロ酢酸アミド(化合物No. 1-5)の製造

[化13]



水素化ナトリウム0. 04g (1. 0ミリモル)をテトラヒドロフラン5ml溶液に懸濁させ氷水冷下、N-{4-[5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-2-イソキサゾリン-3-イル]フェニル}トリフルオロ酢酸アミド0. 4g (0. 85ミリモル)のテトラヒドロフラン5ml溶液を滴下した。室温1時間攪拌後、再び氷冷し沃化メチル0. 15g (1. 0ミリモル)のテトラヒドロフラン5ml溶液を滴下した。室温に戻し、12時間攪拌した後、反応溶液を氷水中に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウム

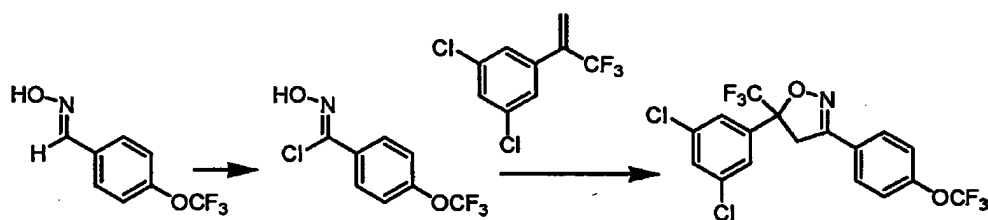
ムで乾燥した後、減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製して、目的物0.32gを得た。

収率:78%

物性:屈折率 $n_D = 1.5384$ (19.8°C)

[0105] 実施例3. 5-(3,5-ジクロロフェニル)-3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-5-トリフルオロメチル-2-イソキサゾリン(化合物No. 2-1)の製造

[化14]



4-トリフルオロメトキシベンズアルドキシム0.30g(1.5ミリモル)のテトラヒドロフラン5ml溶液にN-クロロコハク酸イミド0.20g(1.5ミリモル)を添加し、室温で90分間攪拌した。次いで3,5-ジクロロ-1-(1-トリフルオロメチルエテニル)ベンゼン0.32g(1.3ミリモル)およびトリエチルアミン0.15g(1.5ミリモル)を加え、室温にてさらに3時間攪拌した。反応混合物を水(20ml)にあげ、酢酸エチルで抽出、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製して、目的物0.46g得た。

収率:78%

物性:融点 40~41°C

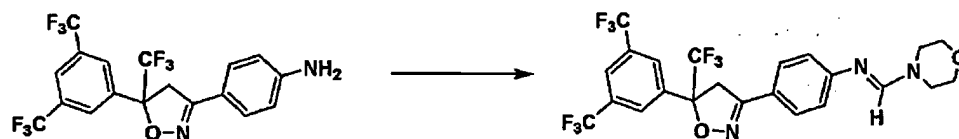
[0106] 実施例4. 5-[3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]-3-(4-モルホリノメチリデンアミノ)フェニル-5-トリフルオロメチル-2-イソキサゾリン(化合物No. 1-144)の製造

[化15]

WO 2007/125984

64

PCT/JP2007/059040



4-〔5-〔3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル〕-5-トリフルオロメチル-2-イソキサゾリン-3-イル〕アニリン150mg(0. 34ミリモル)をオルトギ酸メチル3. 0ml(大過剰量)に溶解し100℃にて3時間攪拌した。減圧下に溶媒を除去した後、トルエンを加えて数回共沸操作を行った。こうして得られたイミデート体をメタノール3. 0mlに溶解し、モルホリン59mg(0. 68ミリモル)を加え、室温にて5時間攪拌した。溶液を減圧濃縮した後、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーによって精製し、目的化合物172mgを得た。

収率:94%

物性:融点 149~151℃

[0107] 実施例5. 5-(3, 5-ジクロロフェニル)-3-[4-(1-モルホリノエチリデン)アミノフェニル]-5-トリフルオロメチル-2-イソキサゾリン(化合物No. 1-107)の製造

[化16]



N-〔5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-2-イソキサゾリン-3-イル〕フェニルアセトアミド200mg(0. 48ミリモル)をトルエン/ジオキサン(2. 0ml/0. 2ml)の混合溶媒に溶解し、五塩化リン150mg(0. 72ミリモル)を加え、還流下2時間攪拌した。減圧下にて濃縮した後、得られた残渣をTHF(2. 0ml)に溶解し、0℃でモルホリン125mg(1. 4ミリモル)、トリエチルアミン363mg(3. 6ミリモル)のTHF2. 0ml溶液に滴下した。この反応混合物を室温にて5時間攪拌した後、反応溶媒を減圧下にて除去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製

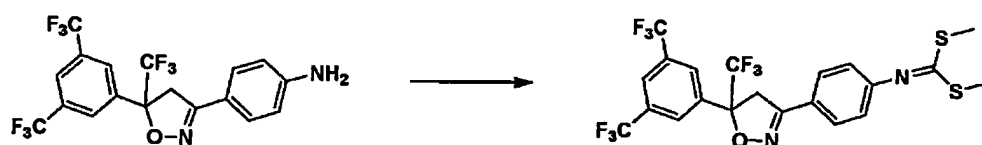
し、目的化合物159mgを得た。

収率:68%

物性:融点 154~158℃

[0108] 実施例6. 5-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]-3-[4-ビス(メチルチオ)メチリデンアミノ]フェニル-5-トリフルオロメチル-2-イソキサゾリン(化合物No. 1-159)の製造

[化17]



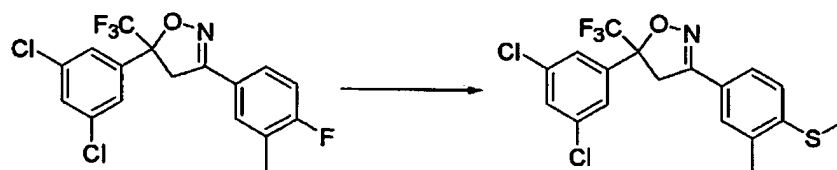
4-{5-[3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]-5-トリフルオロメチル-2-イソキサゾリン-3-イル}アニリン500mg(1.1ミリモル)をDMF5.0mlに溶解し0℃にて水素化ナトリウム135mg(60%, 3.4ミリモル)を加え30分攪拌した。同温度にて二硫化炭素130mg(1.7ミリモル)を加え室温に戻し、30分攪拌した。再び0℃に冷却しヨウ化メチル345mg(3.4ミリモル)を加えた後、室温にてさらに3時間攪拌した。反応溶液を酢酸エチルにて希釈した後、水、飽和食塩水で順次洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥、濾別した後、濾液を濃縮し得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し目的化合物286mgを得た。

収率:46%

物性:屈折率 $n_D = 1.5474$ (20.3℃)

[0109] 実施例7. 5-(3, 5-ジクロロフェニル)-3-(3-メチル-4-メチルチオ)フェニル-5-トリフルオロメチル-2-イソキサゾリン(化合物No. 2-10)の製造

[化18]



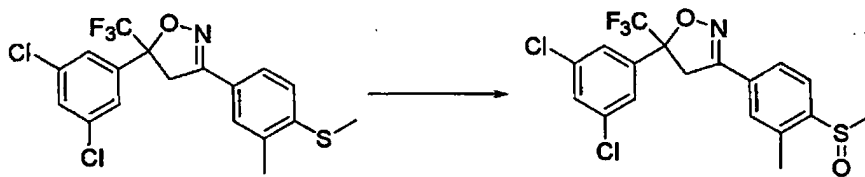
5-(3, 5-ジクロロフェニル)-3-(4-フルオロ-3-メチルフェニル)-5-トリフルオロメチル-2-イソキサゾリン 5.0g (12.7ミリモル) のDMF (40ml) 溶液にソディウムチオメトキシド 1.07g (15.3ミリモル) を加え4時間攪拌した。反応完結後、水100mlを加え、酢酸エチル100mlで抽出した。有機層を水洗、飽和食塩水で洗浄後無水硫酸ナトリウムで乾燥、減圧下にて溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、目的物3.65gを得た。

収率:68%

物性:融点 117~118℃

[0110] 実施例8. 5-(3, 5-ジクロロフェニル)-3-(3-メチル-4-メチルスルフィニル)フェニル-5-トリフルオロメチル-2-イソキサゾリン (化合物No. 2-18) の製造

[化19]



5-(3, 5-ジクロロフェニル)-3-(3-メチル-4-メチルチオ)フェニル-5-トリフルオロメチル-2-イソキサゾリン 4.2g (10.0ミリモル) のクロロホルム (50ml) 溶液に氷冷下メタクロロ過安息香酸 2.5g (純度70%, 102ミリモル) を加え30分攪拌した。反応混合物に水 (100ml) を加え、炭酸カリウムを加え塩基性にした後、クロロホルム (100ml) で抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥、減圧下にて溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、目的物3.91gを得た。

収率:90%

物性:¹H-NMR (CDCl₃/TMS, δ 値ppm)

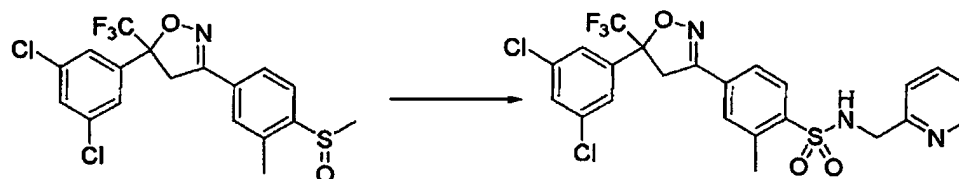
7.78(1H, d), 7.75(1H, d), 7.69(1H, dt), 7.54(1H, m), 7.47(1H, m),

7.06(1H, t), 4.12(1H, d), 3.75(1H, d), 2.79(3H, d), 3.08(3H, s)

[0111] 実施例9. 4-[5-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-2-イソキ

サゾリン-3-イル]-2-メチル-N-(2-ピリジルメチル)ベンゼンスルホン酸アミ
ド(化合物No. 2-20)の製造

[化20]



5-(3,5-ジクロロフェニル)-3-(3-メチル-4-メチルスルフィニルフェニル)-
-5-トリフルオロメチル-2-イソキサゾリン3. 65g(8.3ミリモル)にトリフルオロ酢
酸無水物20mlを加え、還流温度で2時間攪拌後、減圧下でトリフルオロ酢酸無水物
を留去した。反応混合物をメタノール(75ml)とトリエチルアミン(75ml)の混合物に
滴下し、減圧下溶媒を留去した。残渣に飽和塩化アンモニウム水溶液(50ml)を加
え、酢酸エチル(50ml)で抽出、飽和食塩水で洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。
溶媒を減圧下留去後、アセトニトリル(30ml)を加え、氷冷下、硝酸カリウム1.87g(
18.5ミリモル)、塩化スルフル2.5g(18.5ミリモル)を加え、3時間攪拌した。反応
完結後、炭酸ナトリウム水溶液を加え中和し、酢酸エチルで抽出、飽和食塩水で洗
浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、これを氷冷下2-ピリジ
ルメチルアミン0.5g(4.6ミリモル)、トリエチルアミン1.0mlのクロロホルム(30ml)溶
液に加え2時間攪拌した。反応混合物に水を加え、酢酸エチル(100ml)で抽出、水
洗、飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、シ
リカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、目的物1.07gを得た。

収率:24%

物性:¹H-NMR(CDCl₃/TMS, δ 値ppm)

8.48(1H, d), 8.04(1H, d), 7.49-7.60(3H, m), 7.43(1H, t), 7.17(1H, dd),

7.08(1H, d), 6.12(1H, t), 4.23(2H, d), 4.05(1H, d), 3.67(1H, d), 2.71(3H, s)

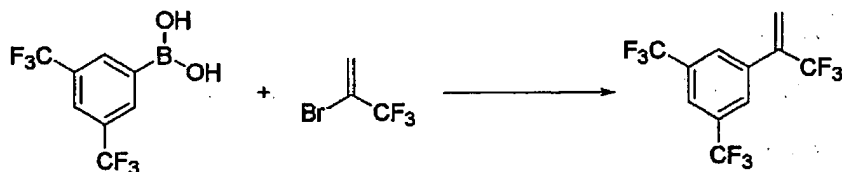
[0112] 実施例10. 3,5-ビス(トリフルオロメチル)-1-(1-トリフルオロメチルエテニル)
ベンゼンの製造

WO 2007/125984

68

PCT/JP2007/059040

[化21]



3, 5- (ビストリフルオロメチル)フェニルホウ酸50g (194ミリモル) のテトラヒドロフラン250ml及び水125ml溶液に、2-ブromo-3, 3, 3-トリフルオロプロペン36g (206ミリモル)、炭酸カリウム56g (405ミリモル) 及びジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II) 2. 6g (37ミリモル) を添加し、加熱還流下にて3時間攪拌した。反応完結後、室温まで放冷、水500mlを加え、エーテル500mlにて抽出した。有機層を水洗、飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥、減圧かにて溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、目的物49gを得た。

収率:82%

物性:¹H-NMR(CDCl₃/TMS, δ 値ppm)

7.92(1H,s), 7.89(2H,s), 6.18(1H,d), 5.93(1H.d)

[0113] 以下に本発明の代表的な製剤例及び試験例を示すが、本発明はこれらに限定されるものではない。

尚、製剤例中、部とあるのは重量部を示す。

製剤例1.

本発明化合物	10部
キシレン	70部
N-メチルピロリドン	10部
ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと	
アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物	10部
以上を均一に混合溶解して乳剤とする。	

製剤例2.

本発明化合物	3部
クレイ粉末	82部

珪藻土粉末 15部

以上を均一に混合粉碎して粉剤とする。

[0114] 製剤例3.

本発明化合物 5部

ベントナイトとクレーの混合粉末 90部

リグニンスルホン酸カルシウム 5部

以上を均一に混合し、適量の水を加えて混練し、造粒、乾燥して粒剤とする。

製剤例4.

本発明化合物 20部

カオリンと合成高分散珪酸 75部

ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと

アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物 5部

以上を均一に混合粉碎して水和剤とする。

[0115] 試験例1. コナガ (*Plutella xylostella*) に対する殺虫試験

ハクサイ実生にコナガの成虫を放飼して産卵させ、放飼2日後に産下卵の付いたハクサイ実生を本発明化合物を有効成分とする薬剤を500ppmに希釈した薬液に約30秒間浸漬し、風乾後に25℃の恒温室に静置した。薬液浸漬6日後に孵化虫数を調査し、下記の式により死虫率を算出し、下記基準に従って判定を行った。1区10頭2連制。結果を第10表に示す。尚、第10表中「—」は試験未実施を示す。

[数1]

$$\text{死虫率(\%)} = \frac{\text{無処理区孵化虫数} - \text{処理区孵化虫数}}{\text{無処理区孵化虫数}} \times 100$$

判定基準. A・・・死虫率100%

B・・・死虫率99%～90%

C・・・死虫率89%～80%

D・・・死虫率79%～50%

WO 2007/125984

70

PCT/JP2007/059040

[0116] 試験例2. ハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*) に対する殺虫試験

本発明化合物を有効成分とする薬剤を500ppmに希釈した薬液にキャベツ葉片(品種: 四季穫)を約30秒間浸漬し、風乾後に直径9cmのプラスチックシャーレに入れ、ハスモンヨトウ2令幼虫を接種した後、蓋をして25℃の恒温室に静置した。接種8日後に生死虫数を調査し、下記の式により死虫率を算出し、判定基準は試験例1に従って行った。1区10頭2連制。結果を第10表に示す。

[数2]

$$\text{死虫率(\%)} = \frac{\text{無処理区生存虫数} - \text{処理区生存虫数}}{\text{無処理区生存虫数}} \times 100$$

[0117] 試験例3. チャノコカクモンハマキ (*Adoxophyes* sp.) に対する殺虫試験

本発明化合物を有効成分とする薬剤を500ppmに希釈した薬液にチャ葉を約30秒間浸漬し、風乾後に直径9cmのプラスチックシャーレに入れ、チャノコカクモンハマキ幼虫を接種した後、25℃、湿度70%の恒温室に静置した。接種8日後に生死虫数を調査し、試験例2と同様に判定を行った。1区10頭2連制。結果を第10表に示す。

[0118] [表10-1]

WO 2007/125984

71

PCT/JP2007/059040

第 10 表

No.	コナガ	ハスモンヨトウ	チャノコカクモンハマキ
1-1	A	A	A
1-2	B	A	A
1-3	B	—	A
1-4	—	A	A
1-5	A	A	A
1-6	—	B	A
1-7	A	A	A
1-8	A	A	A
1-9	B	A	A
1-10	—	A	A
1-11	B	A	A
1-12	—	A	A
1-13	—	A	A
1-14	A	A	A
1-15	—	A	A
1-16	—	A	A
1-17	C	—	A
1-18	A	A	A
1-19	—	A	A
1-20	B	A	A
1-21	—	—	A
1-22	C	—	A
1-23	A	B	A
1-24	—	—	A
1-25	—	A	A
1-26	—	A	A
1-27	C	—	A
1-28	C	—	A
1-30	—	B	A
1-31	A	A	A
1-32	—	A	A
1-33	A	A	A
1-34	—	A	A
1-35	A	A	A
1-36	—	—	A
1-37	C	—	A
1-38	B	B	A
1-39	B	A	A
1-40	—	C	A
1-41	—	A	A
1-42	—	A	—
1-43	A	A	A

[0119] [表10-2]

第 10 表 (続き)

No.	コナガ	ハスモンヨトウ	チャノコカクモンハマキ
1-45	—	—	A
1-46	—	A	A
1-47	—	A	A
1-48	A	B	B
1-49	—	—	A
1-50	A	C	B
1-51	—	A	A
1-52	—	—	A
1-53	—	C	A
1-54	A	—	A
1-55	—	C	A
1-56	B	—	A
1-57	A	A	A
1-58	—	A	A
1-60	—	—	A
1-61	—	A	A
1-62	A	A	A
1-63	A	A	A
1-64	A	—	A
1-65	A	A	A
1-66	A	—	A
1-67	—	—	A
1-68	—	—	A
1-70	A	A	A
1-71	A	A	A
1-72	A	A	A
1-73	—	A	A
1-74	—	A	A
1-75	A	A	A
1-76	—	—	A
1-77	A	A	A
1-78	A	A	A
1-79	—	A	A
1-80	A	A	A
1-81	—	—	A
1-82	—	B	A
1-83	C	—	A
1-84	—	A	A
1-85	A	A	A
1-87	A	A	A
1-88	A	—	A
1-89	A	A	A

WO 2007/125984

73

PCT/JP2007/059040

第10表 (続き)

No.	コナガ	ハスモンヨトウ	チャノコカクモンハマキ
1-90	A	A	A
1-91	A	—	A
1-92	—	—	A
1-93	—	B	A
1-94	—	B	A
1-95	—	—	A
1-96	B	—	A
1-97	—	A	A
1-98	—	—	A
1-100	A	A	A
1-101	A	—	A
1-102	—	A	A
1-103	—	—	A
1-107	A	A	A
1-108	—	—	A
1-109	C	—	A
1-110	—	A	A
1-111	B	A	A
1-112	—	—	A
1-113	B	A	A
1-114	A	A	A
1-115	A	A	A
1-116	—	—	A
1-117	—	A	A
1-118	A	A	A
1-119	A	A	A
1-120	A	A	A
1-121	A	A	A
1-122	A	A	A
1-123	—	—	A
1-124	B	A	A
1-125	B	A	A
1-126	—	A	A
1-127	A	A	A
1-128	—	A	A
1-129	A	A	A
1-130	—	A	A
1-131	—	A	A
1-132	B	A	A
1-133	—	A	A
1-134	A	A	A
1-135	A	A	A

WO 2007/125984

74

PCT/JP2007/059040

第10表 (続き)

No.	コナガ	ハスモンヨトウ	チャノコカクモンハマキ
1-136	A	A	A
1-137	A	A	A
1-138	A	A	A
1-139	A	A	A
1-140	—	A	A
1-141	A	A	A
1-142	—	A	A
1-143	—	—	A
1-144	—	A	A
1-145	A	A	A
1-146	A	A	A
1-147	—	A	A
1-148	—	A	A
1-149	A	A	A
1-150	A	A	A
1-151	—	A	A
1-152	—	A	A
1-153	A	A	A
1-154	A	A	A
1-155	—	A	A
1-156	—	A	A
1-157	—	A	A
1-158	A	A	A
1-159	—	A	A
1-160	A	A	A
1-161	A	A	A
1-162	A	A	A
2-1	A	A	A
2-2	A	A	A
2-3	A	A	A
2-4	A	—	A
2-5	A	A	A
2-7	A	A	A
2-8	A	A	A
2-9	A	A	A
2-10	A	A	A
2-11	A	A	A
2-12	A	—	A
2-13	A	—	A
2-14	A	B	A

[0122] [表10-5]

WO 2007/125984

75

PCT/JP2007/059040

第10表 (続き)

No.	コナガ	ハスモンヨトウ	チャノコカクモンハマキ
2-15	A	—	A
2-16	A	B	A
2-17	A	A	A
2-18	—	A	A
2-19	A	C	A
2-20	—	—	A
2-21	A	A	A
2-22	—	—	A
2-23	A	A	A
2-24	A	A	A
2-25	A	A	A
2-26	A	A	A
2-27	A	A	A
2-28	A	A	A
2-29	A	A	A
2-30	A	A	A
2-31	A	A	A
2-32	—	—	A
2-34	A	—	A
2-35	—	—	A
2-36	A	A	A
2-37	—	—	A
2-38	B	A	A
2-39	—	A	A
2-40	B	—	A
2-41	C	C	A
2-42	A	—	A
2-43	—	—	A
2-44	A	A	A
2-45	A	A	A
2-46	A	A	A
2-47	A	A	A
2-49	—	B	A
2-50	—	A	A
2-51	A	A	A
2-52	A	—	A
2-53	A	A	A
2-56	—	B	A
2-57	A	B	A
2-58	—	—	A

[0123] [表10-6]

第 10 表 (続き)

No.	コナガ	ハスモンヨトウ	チャノコカクモンハマキ
2-59	A	A	A
2-60	—	—	A
2-61	—	—	A
2-62	A	A	A
2-63	A	A	A
2-64	A	—	—
2-65	—	—	A
2-68	—	B	A
2-69	B	—	A
2-70	A	A	A
2-71	A	A	A
2-72	A	A	A
2-73	A	A	A
2-74	A	A	A
2-75	A	A	A
2-76	A	A	A
2-77	A	A	A
2-78	A	A	A
2-79	A	A	A
2-80	A	A	A
2-81	A	A	A
2-82	A	A	A
2-83	A	A	A
2-84	A	A	A
2-85	A	A	A
2-86	A	A	A
2-87	A	A	A
2-88	A	A	A
2-89	A	A	A
2-90	A	A	A
2-91	A	A	A
2-92	A	A	A
2-93	A	A	A
2-94	A	A	A
3-1	A	A	A
3-2	A	A	A
3-4	—	—	A
3-5	A	A	A
3-6	A	A	A
3-7	A	A	A

第10表 (続き)

No.	コナガ	ハスモンヨトウ	チャノコカクモンハマキ
3-8	A	A	A
3-9	A	A	A
3-10	A	A	A
3-11	—	—	A
3-12	A	A	A
3-13	—	—	A
3-14	A	A	A
3-15	—	—	A
3-16	B	—	A
3-17	A	A	A
3-18	—	B	A
3-19	A	A	A
3-20	A	A	A
3-21	A	A	A
3-22	A	A	A
3-23	A	A	A
3-24	A	—	A
3-25	A	A	A
3-26	A	A	A
3-27	A	A	A
3-28	A	A	A
3-29	A	A	A
3-30	A	A	A
3-31	A	A	A
3-32	A	A	A
3-33	A	A	A
3-34	A	—	A
3-35	A	A	A
3-36	A	—	A
3-37	A	—	A
3-38	A	A	A
3-39	A	—	A
3-40	A	A	A
3-41	A	A	A
4-1	A	A	A
4-2	A	A	A
4-3	A	A	A
4-4	A	B	A
8-3	A	A	A
8-23	—	C	A

産業上の利用可能性

[0125] 本発明の化合物は、地球環境への負荷が少なく、有害生物、特に農園芸害虫に対

WO 2007/125984

78

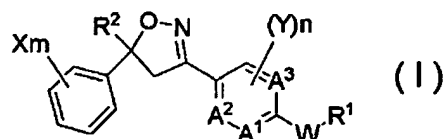
PCT/JP2007/059040

して低薬量で広い防除スペクトラムを有し、優れた防除効果を示す有害生物防除剤、特に農園芸用殺虫剤として有用である。

請求の範囲

[1] 一般式(I)

[化1]



(式中、R¹は水素原子;ハロゲン原子;(C₁~C₆)アルキル基;Zにより置換された置換(C₁~C₆)アルキル基;(C₃~C₇)シクロアルキル基;Zにより置換された置換(C₃~C₇)シクロアルキル基;(C₂~C₆)アルケニル基;Zにより置換された置換(C₂~C₆)アルケニル基;(C₂~C₆)アルキニル基;Zにより置換された置換(C₂~C₆)アルキニル基;フェニル基;Zにより置換された置換フェニル基;複素環基、Zにより置換された置換複素環基;モノ(C₁~C₆)アルキルアミノ基;Zにより置換された置換モノ(C₁~C₆)アルキルアミノ基;同一又は異なっても良いジ(C₁~C₆)アルキルアミノ基;Zにより置換された同一又は異なっても良い置換ジ(C₁~C₆)アルキルアミノ基;フェニルアミノ基;Zにより置換された置換フェニルアミノ基;複素環アミノ基;Zにより置換された置換複素環アミノ基;ホルミル基;(C₁~C₆)アルキルカルボニル基;Zにより置換された置換(C₁~C₆)アルキルカルボニル基;(C₁~C₆)シクロアルキルカルボニル基;Zにより置換された置換(C₁~C₆)シクロアルキルカルボニル基;(C₁~C₆)アルコキシカルボニル基;Zにより置換された置換(C₁~C₆)アルコキシカルボニル基;(C₁~C₆)アルキルチオカルボニル基;Zにより置換された置換(C₁~C₆)アルキルチオカルボニル基;ベンゾイル基;Zにより置換された置換ベンゾイル基、複素環カルボニル基;Zにより置換された置換複素環カルボニル基;モノ(C₁~C₆)アルキルアミノカルボニル基;Zにより置換された置換モノ(C₁~C₆)アルキルアミノカルボニル基;同一又は異なっても良いジ(C₁~C₆)アルキルアミノカルボニル基;Zにより置換された同一又は異なっても良い置換ジ(C₁~C₆)アルキルアミノカルボニル基;フェニルアミノカルボニル基;Zにより置換された置換フェニルアミノカルボニル基;複素環アミノカルボニル基;Zにより置換された置換複素環アミノカルボニル基;(C₁~C₆)アルキルスルホニル基;Z

により置換された置換($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル基;フェニルスルホニル基;Zにより置換された置換フェニルスルホニル基;モノ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノスルホニル基;Zにより置換された置換モノ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノスルホニル基;同一又は異なっても良いジ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノスルホニル基;Zにより置換された同一又は異なっても良い置換ジ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノスルホニル基;フェニルアミノスルホニル基;又はZにより置換された置換フェニルアミノスルホニル基を示す。

R^2 はハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル基を示す。

Wは酸素原子;硫黄原子; $-\text{SO}-$; $-\text{SO}_2-$; $-\text{N}(\text{R}^3)-$ (式中、 R^3 は水素原子; ($C_1 \sim C_6$)アルキル基;Zにより置換された($C_1 \sim C_6$)アルキル基;($C_1 \sim C_6$)シクロアルキル基;Zにより置換された($C_1 \sim C_6$)シクロアルキル基;シアノ基;ホルミル基;チオホルミル基;($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル基;Zにより置換された置換($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル基;($C_1 \sim C_6$)アルコキシカルボニル基;Zにより置換された置換($C_1 \sim C_6$)アルコキシカルボニル基;($C_1 \sim C_6$)アルキルチオカルボニル基;Zにより置換された置換($C_1 \sim C_6$)アルキルチオカルボニル基;ベンゾイル基;Zにより置換された置換ベンゾイル基;複素環カルボニル基;Zにより置換された置換複素環カルボニル基;モノ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノカルボニル基;Zにより置換された置換モノ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノカルボニル基;モノ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノチオカルボニル基;Zにより置換された置換モノ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノチオカルボニル基;同一又は異なっても良いジ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノカルボニル基;Zにより置換された同一又は異なっても良い置換ジ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノカルボニル基;フェニルアミノカルボニル基;Zにより置換された置換フェニルアミノカルボニル基;複素環アミノカルボニル基;Zにより置換された置換複素環アミノカルボニル基;($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル基;Zにより置換された置換($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル基;フェニルスルホニル基;Zにより置換された置換フェニルスルホニル基;モノ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノスルホニル基;Zにより置換された置換モノ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノスルホニル基;同一又は異なっても良いジ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノスルホニル基;Zにより置換された同一又は異なっても良い置換ジ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノスルホニル基;フェニルアミノスルホニル基;又はZにより置換された置換フェニルアミノスルホニル基を示す。又、 R^3 は R^1 と一緒に

なって $=C(R^7)NR^8R^9$ (式中、 R^7 、 R^8 及び R^9 は同一又は異なっても良く、水素原子;
 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル基; Z により置換された $(C_1 \sim C_6)$ アルキル基; $(C_1 \sim C_6)$ アルケニ
 ル基; Z により置換された $(C_1 \sim C_6)$ アルケニル基; $(C_1 \sim C_6)$ アルキニル基; Z により
 置換された $(C_1 \sim C_6)$ アルキニル基; $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ基; Z により置換された $(C_1$
 $\sim C_6)$ アルコキシ基;フェニル基; Z により置換された置換フェニル基;複素環基;又は
 Z により置換された置換複素環基を示す。又、 R^8 と R^9 は結合して、ピロリジン環、ピペ
 リジン環、ピペラジン環、モリホリン環、チオモルホリン環及び4-オキソチオモルホリ
 ン環から選択される複素環を形成することができ、該複素環は Z により置換されてい
 ても良い。)又は $=C(SR^{10})_2$ (式中、 R^{10} は $(C_1 \sim C_6)$ アルキル基又は Z により置換さ
 れた置換 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル基を示す。)で表される基を示すことができる。)を示す。
);又は $-C(R^4)(R^5)-$ (式中、 R^4 及び R^5 は同一又は異なっても良く、水素原子又は
 ハロゲン原子を示す。)を示す。

A^1 、 A^2 及び A^3 は同一又は異なっても良く、窒素原子; $C-H$;又は $C-Y$ を示す。

X はハロゲン原子;シアノ基;ニトロ基; $(C_1 \sim C_6)$ アルキル基;ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル
 基; $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル基;ハロ $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル基; $(C_1 \sim C_6)$ アルコキ
 シ基;ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ基; $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルコキシ基;ハロ $(C_3 \sim C_7)$ シク
 ロアルコキシ基; $(C_1 \sim C_6)$ アルキルチオ基;ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキルチオ基; $(C_3 \sim C_7)$
 シクロアルキルチオ基;ハロ $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルチオ基; $(C_1 \sim C_6)$ アルキルス
 ルフィニル基;ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキルスルフィニル基; $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルスル
 フィニル基;ハロ $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルスルフィニル基; $(C_1 \sim C_6)$ アルキルスルホ
 ニル基;ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキルスルホニル基; $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルスルホニル
 基;ハロ $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルスルホニル基;フェニル基; Z により置換された置換
 フェニル基;複素環基;又は Z により置換された置換複素環基を示し、 m は1~5の整
 数を示す。

Y はハロゲン原子;シアノ基;ニトロ基; $(C_1 \sim C_6)$ アルキル基; Z により置換された $(C_1$
 $\sim C_6)$ アルキル基; $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル基; Z により置換された $(C_3 \sim C_7)$ シクロ
 アルキル基; $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ基; Z により置換された $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ基; $(C_3$
 $\sim C_7)$ シクロアルコキシ基; Z により置換された $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルコキシ基; $(C_1 \sim C$

)アルキルチオ基;Zにより置換された($C_1 \sim C_6$)アルキルチオ基;($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルチオ基;Zにより置換された($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルチオ基;($C_1 \sim C_6$)アルキルスルフィニル基;Zにより置換された($C_1 \sim C_6$)アルキルスルフィニル基;($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルスルフィニル基;Zにより置換された($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルスルフィニル基;($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル基;Zにより置換された($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル基;($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルスルホニル基;Zにより置換された($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルスルホニル基;フェニル基;Zにより置換された置換フェニル基;複素環基;Zにより置換された置換複素環基;フェノキシ基;Zにより置換された置換フェノキシ基;複素環オキシ基;Zにより置換された置換複素環オキシ基;($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル基;Zにより置換された置換($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル基;($C_1 \sim C_6$)アルコキシカルボニル基;Zにより置換された置換($C_1 \sim C_6$)アルコキシカルボニル基;($C_1 \sim C_6$)アルキルチオカルボニル基;Zにより置換された置換($C_1 \sim C_6$)アルキルチオカルボニル基;ベンゾイル基;Zにより置換された置換ベンゾイル基;複素環カルボニル基;Zにより置換された置換複素環カルボニル基;モノ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノカルボニル基;Zにより置換された置換モノ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノカルボニル基;同一又は異なっても良いジ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノカルボニル基;Zにより置換された同一又は異なっても良い置換ジ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノカルボニル基;フェニルアミノカルボニル基;Zにより置換された置換フェニルアミノカルボニル基;複素環アミノカルボニル基;Zにより置換された置換複素環アミノカルボニル基;($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル基;Zにより置換された置換($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル基;フェニルスルホニル基;Zにより置換された置換フェニルスルホニル基;モノ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノスルホニル基;Zにより置換された置換モノ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノスルホニル基;同一又は異なっても良いジ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノスルホニル基;Zにより置換された同一又は異なっても良い置換ジ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノスルホニル基;フェニルアミノスルホニル基;Zにより置換された置換フェニルアミノスルホニル基;モノ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノ基;Zにより置換された置換モノ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノ基;同一又は異なっても良いジ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノ基;Zにより置換された同一又は異なっても良い置換ジ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノ基;フェニルアミノ基;Zにより置換された置換

フェニルアミノ基、複素環アミノ基;Zにより置換された置換複素環アミノ基;モノ($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニルアミノ基;Zにより置換された置換モノ($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニルアミノ基;同一又は異なっても良いジ($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニルアミノ基;Zにより置換された同一又は異なっても良い置換ジ($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニルアミノ基;フェニルカルボニルアミノ基;Zにより置換された置換フェニルカルボニルアミノ基;複素環カルボニルアミノ基;Zにより置換された置換複素環カルボニルアミノ基;モノ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニルアミノ基;Zにより置換された置換モノ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニルアミノ基;同一又は異なっても良いジ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニルアミノ基;Zにより置換された同一又は異なっても良い置換ジ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニルアミノ基;フェニルスルホニルアミノ基;Zにより置換された置換フェニルスルホニルアミノ基;複素環スルホニルアミノ基;又はZにより置換された置換複素環スルホニルアミノ基を示し、nは0～4の整数を示す。

Zは同一又は異なっても良く、ハロゲン原子;シアノ基;ニトロ基;($C_1 \sim C_6$)アルキル基;ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル基;シクロ($C_3 \sim C_7$)アルキル基;ハロシクロ($C_3 \sim C_7$)アルキル基;($C_1 \sim C_6$)アルコキシ基;ハロ($C_1 \sim C_6$)アルコキシ基;($C_1 \sim C_6$)アルキルチオ基;ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルチオ基;($C_1 \sim C_6$)アルキルスルフィニル基;ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルフィニル基;($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル基;ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル基;($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル基;ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル基;モノ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノ基;同一又は異なっても良いジ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノ基;フェニル基;同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、($C_1 \sim C_6$)アルキル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルキル基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルキル基、($C_1 \sim C_6$)アルコキシ基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルコキシ基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルコキシ基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルコキシ基、($C_1 \sim C_6$)アルキルチオ基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルチオ基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルチオ基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルチオ基、($C_1 \sim C_6$)アルキルスルフィニル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルフィニル基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルスルフィニル基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルスルフィニル基、($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルスルホニル基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロ

アルキルスルホニル基、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルカルボニル基、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキルカルボニル基、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル基、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル基、フェニル基及び複素環基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基;複素環基;同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル基、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル基、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル基、ハロ $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル基、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ基、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ基、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルコキシ基、ハロ $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルコキシ基、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルチオ基、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキルチオ基、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルチオ基、ハロ $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルチオ基、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルスルフィニル基、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキルスルフィニル基、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルスルフィニル基、ハロ $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルスルフィニル基、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルスルホニル基、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキルスルホニル基、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルスルホニル基、ハロ $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルスルホニル基、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルカルボニル基、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキルカルボニル基、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル基、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル基、フェニル基及び複素環基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基;フェノキシ基;同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル基、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル基、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル基、ハロ $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル基、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ基、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ基、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルコキシ基、ハロ $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルコキシ基、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルチオ基、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキルチオ基、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルチオ基、ハロ $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルチオ基、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルスルフィニル基、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキルスルフィニル基、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルスルフィニル基、ハロ $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルスルフィニル基、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルスルホニル基、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキルスルホニル基、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルスルホニル基、ハロ $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルスルホニル基、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルカルボニル基、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキルカルボニル基、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル基、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル基、フェニル基及び複素環基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基;複素環オキシ基;同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキ

[illegible]

ルキルチオ基、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルスルフィニル基、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキルスルフィ
ニル基、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルスルフィニル基、ハロ $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルス
ルフィニル基、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルスルホニル基、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキルスルホニル
基、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルスルホニル基、ハロ $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルスルホニル
基、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルカルボニル基、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキルカルボニル基、 $(C_1 \sim$
 $C_6)$ アルコキシカルボニル基、ハロ $(C$
 $_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル基、フェニル基及び複素環基から選択される1以上の
置換基を有する置換複素環チオ基；モノ $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミノ基；同一又は異な
っても良いジ $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミノ基；フェニルアミノ基；同一又は異なっても良く
、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル基、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル
基、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル基、ハロ $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル基、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコ
キシ基、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ基、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルコキシ基、ハロ $(C_3 \sim C_7)$
シクロアルコキシ基、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルチオ基、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキルチオ基、 $(C$
 $_3 \sim C_7)$ シクロアルキルチオ基、ハロ $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルチオ基、 $(C_1 \sim C_6)$ アル
キルスルフィニル基、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキルスルフィニル基、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキ
ルスルフィニル基、ハロ $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルスルフィニル基、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル
スルホニル基、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキルスルホニル基、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルスル
ホニル基、ハロ $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルスルホニル基、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルカルボニ
ル基、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキルカルボニル基、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル基、ハ
ロ $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル基、フェニル基及び複素環基から選択される1以
上の置換基を環上に有する置換フェニルアミノ基；複素環アミノ基；同一又は異なっ
ても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル基、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ ア
ルキル基、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル基、ハロ $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル基、 $(C_1 \sim C_6)$
アルコキシ基、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ基、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルコキシ基、ハロ $(C_3$
 $\sim C_7)$ シクロアルコキシ基、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルチオ基、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキルチオ
基、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルチオ基、ハロ $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルチオ基、 $(C_1 \sim C$
 $_6)$ アルキルスルフィニル基、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキルスルフィニル基、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロ
アルキルスルフィニル基、ハロ $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルスルフィニル基、 $(C_1 \sim C_6)$ ア

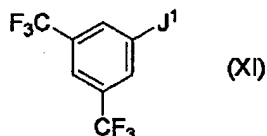
WO 2007/125984

87

PCT/JP2007/059040

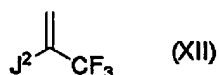
ルキルスルホニル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル基、($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルスルホニル基、ハロ($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルスルホニル基、($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル基、($C_1 \sim C_6$)アルコキシカルボニル基、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルコキシカルボニル基、フェニル基及び複素環基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換複素環アミノ基；($C_1 \sim C_6$)アルコキシカルボニル基；又はハロ($C_1 \sim C_6$)アルコキシカルボニル基から選択される1～5個の置換基を示す。)で表されるイソキサゾリン誘導体又はその塩。

- [2] Wが酸素原子、硫黄原子、 $-SO-$ 、又は $-SO_2-$ である請求項1に記載のイソキサゾリン誘導体又はその塩。
- [3] Wが $-N(R^3)-$ (式中、 R^3 は請求項1に同じ。)である請求項1に記載のイソキサゾリン誘導体又はその塩。
- [4] Wが $-C(R^4)(R^5)-$ (式中、 R^5 及び R^6 は請求項1に同じ。)である請求項1に記載のイソキサゾリン誘導体又はその塩。
- [5] R^2 がフルオロ($C_1 \sim C_6$)アルキル基である請求項1乃至4いずれか1項に記載のイソキサゾリン誘導体又はその塩。
- [6] R^2 がトリフルオロメチル基である請求項1乃至4いずれか1項に記載のイソキサゾリン誘導体又はその塩。
- [7] Xがハロゲン原子又はハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル基である請求項1乃至6いずれか1項に記載のイソキサゾリン誘導体又はその塩。
- [8] 請求項1乃至7いずれか1項に記載のイソキサゾリン誘導体又はその塩を有効成分とする有害生物防除剤。
- [9] 有害生物防除剤が農園芸用殺虫剤である請求項8に記載の有害生物防除剤。
- [10] 有用植物から有害生物を防除するために、請求項8又は9に記載の殺虫剤の有効量を対象植物又は土壌に処理することを特徴とする殺虫剤の使用法。
- [11] 一般式(XI)
- [化2]



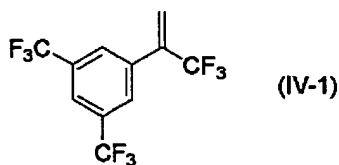
(式中、 J^1 は塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、 $(C_1 \sim C_4)$ アルキルスルホニルオキシ基、ハロ $(C_1 \sim C_4)$ アルキルスルホニルオキシ基、 $-B(OH)_2$ 基、 $-B(OMe)_2$ 基、 $-B(OEt)_2$ 基、4, 4, 5, 5-テトラメチル-1, 3, 2-ジオキサボラン-2-イル基、 $-Si(OEt)_3$ 基、 $-ZnCl$ 基、 $-ZnBr$ 基、 $-ZnI$ 基、 $-MgCl$ 基、 $-MgBr$ 基又は $-MgI$ 基を示す。)で表される3, 5-ビス(トリフルオロメチル)ベンゼン誘導体と一般式(XII)

[化3]



(式中、 J^2 は塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、 $-B(OH)_2$ 基、 $-B(OMe)_2$ 基、 $-B(OEt)_2$ 基を示す。)で表されるオレフィン類とを、パラジウム、ニッケル等の遷移金属触媒の存在下、クロスカップリングさせることを特徴とする式(IV-1)

[化4]



で表される3, 5-ビス(トリフルオロメチル)-1-(1-トリフルオロメチルエテニル)ベンゼンの製造方法。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2007/059040

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

C07D261/04(2006.01)i, A01N43/80(2006.01)i, A01N43/84(2006.01)i, A01N47/02(2006.01)i, A01P5/00(2006.01)i, A01P7/02(2006.01)i, A01P7/04(2006.01)i, C07D413/04(2006.01)i, C07D413/12(2006.01)i

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

C07D261/04, A01N43/80, A01N43/84, A01N47/02, A01P5/00, A01P7/02, A01P7/04, C07D413/04, C07D413/12

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Jitsuyo Shinan Koho 1922-1996 Jitsuyo Shinan Toroku Koho 1996-2007
Kokai Jitsuyo Shinan Koho 1971-2007 Toroku Jitsuyo Shinan Koho 1994-2007

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CAPLUS (STN), CAOLD (STN), REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
E,X	JP 2007-106756 A (Nissan Chemical Industries, Ltd.), 26 April, 2007 (26.04.07), Full text; particularly, Claims; examples; test examples (Family: none)	1, 2, 5-11
P,X	JP 2007-16017 A (Nissan Chemical Industries, Ltd.), 25 January, 2007 (25.01.07), Full text; particularly, page 59; Par. Nos. [0163] to [0166]; examples (Family: none)	11

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
13 June, 2007 (13.06.07)

Date of mailing of the international search report
26 June, 2007 (26.06.07)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2007/059040

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 2005/085216 A1 (Nissan Chemical Industries, Ltd.), 15 September, 2005 (15.09.05), Full text; particularly, pages 78 to 79, reaction formula 3; pages 334 to 338, tables 17, 20; test examples; Claims & US 2007/66617 A1	1-11
X	JP 2005-35964 A (Nissan Chemical Industries, Ltd.), 10 February, 2005 (10.02.05), Full text; particularly, Claims; examples; test examples & US 2005/250822 A1 & EP 1538138 A1 & WO 2004/018410 A1 & BR 313943 A	1,3,5-10
X	JP 2005-272452 A (Nissan Chemical Industries, Ltd.), 06 October, 2005 (06.10.05), Full text; particularly, Claims; examples; test examples (Family: none)	1,3,5-10
X	JP 2005-272443 A (Nissan Chemical Industries, Ltd.), 06 October, 2005 (06.10.05), Full text; particularly, Claims; examples; test examples (Family: none)	1,3,5-10
Y	US 2909509 A (CRAWFORD, G.H. et al.), 20 October, 1959 (20.10.59), Full text; particularly, page 3, column 6 (Family: none)	11
Y	JIANG, B. et al., alfa-(Trifluoromethyl)ethenyl boronic acid as a useful trifluoromethyl containing building block. Preparation and palladium-catalysed coupling with aryl halides, Tetrahedron Letters, 2001, Vol.42/No.24, p.4083-4085	11
Y	JIANG, B. and Xu, Y., Trifluoroisopropenylzinc Reagents as a Useful alfa-(Trifluoromethyl) ethenyl Carbanion Synthetic Equivalent. Preparation and Palladium-Catalyzed Coupling with Aryl Halides, Journal of Organic Chemistry, 1991.12.20, Vol.56/No.26, p.7336-7340	11
Y	FILLER, R. et al., Synthesis of fluorovinylsalicylic acids and their derivatives, Journal of Fluorine Chemistry, September 1995, Vol.74/No.1, p.69-75	11

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP2007/059040

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	PAN, R. et al., A novel and convenient synthetic method for producing alfa-(trifluoromethyl)styrenes (3), Journal of Fluorine Chemistry, 1999.06.04, Vol.95/No.1-2, p.167-170	11

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2007/059040

Box No. II Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 2 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☐ Claims Nos.:
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
2. ☐ Claims Nos.:
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
3. ☐ Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box No. III Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

The compound relating to the inventions of claims 1-10 and the compound relating to the invention of claim 11 shear no common chemical structure that can be regarded as the same or corresponding special technical features.

Therefore, the inventions of claims 1-10 and the invention of claim 11 do not comply with the requirement of unity of invention.

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. ☒ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4. ☐ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest
the

- ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest and, where applicable, payment of a protest fee..
- ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest but the applicable protest fee was not paid within the time limit specified in the invitation.
- ☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

国際調査報告

国際出願番号 PCT/JP2007/059040

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int.Cl. C07D261/04 (2006.01)i, A01N43/80 (2006.01)i, A01N43/84 (2006.01)i, A01N47/02 (2006.01)i, A01P5/00 (2006.01)i, A01P7/02 (2006.01)i, A01P7/04 (2006.01)i, C07D413/04 (2006.01)i, C07D413/12 (2006.01)i

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int.Cl. C07D261/04, A01N43/80, A01N43/84, A01N47/02, A01P5/00, A01P7/02, A01P7/04, C07D413/04, C07D413/12

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

日本国実用新案公報	1922-1996年
日本国公開実用新案公報	1971-2007年
日本国実用新案登録公報	1996-2007年
日本国登録実用新案公報	1994-2007年

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CAplus (STN), CAOLD (STN), REGISTRY (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリ*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
E, X	JP 2007-106756 A (日産化学工業株式会社) 2007.04.26, 全文、特に、【特許請求の範囲】、実施例、試験例 (ファミリーなし)	1, 2, 5-11
P, X	JP 2007-16017 A (日産化学工業株式会社) 2007.01.25, 全文、特に、第59頁【0163】-【0166】、実施例 (ファミリーなし)	11
X	WO 2005/085216 A1 (日産化学工業株式会社) 2005.09.15, 全文、特に、第78-79頁反応式3、第334-338頁第17表、第20表、試験例、請求の範囲 & US 2007/66617 A1	1-11

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリ

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日後に公表されたもの

「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

13.06.2007

国際調査報告の発送日

26.06.2007

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

當麻 博文

電話番号 03-3581-1101 内線 3452

4C

3543

国際調査報告

国際出願番号 PCT/J P 2 0 0 7 / 0 5 9 0 4 0

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	JP 2005-35964 A (日産化学工業株式会社) 2005. 02. 10, 全文、特に、 【特許請求の範囲】、実施例、試験例 & US 2005/250822 A1 & EP 1538138 A1 & WO 2004/018410 A1 & BR 313943 A	1, 3, 5-10
X	JP 2005-272452 A (日産化学工業株式会社) 2005. 10. 06, 全文、特に、 【特許請求の範囲】、実施例、試験例 (ファミリーなし)	1, 3, 5-10
X	JP 2005-272443 A (日産化学工業株式会社) 2005. 10. 06, 全文、特に、 【特許請求の範囲】、実施例、試験例 (ファミリーなし)	1, 3, 5-10
Y	US 2909509 A (CRAWFORD, G.H. et al.) 1959. 10. 20, 全文、特に、 第3頁6欄 (ファミリーなし)	11
Y	JIANG, B. et al., alfa-(Trifluoromethyl)ethenyl boronic acid as a useful trifluoromethyl containing building block. Preparation and palladium-catalysed coupling with aryl halides, Tetrahedron Letters, 2001, Vol. 42/No. 24, p. 4083-4085	11
Y	JIANG, B. and Xu, Y., Trifluoroisopropenylzinc Reagents as a Useful alfa-(Trifluoromethyl)ethenyl Carbanion Synthetic Equivalent. Preparation and Palladium-Catalyzed Coupling with Aryl Halides, Journal of Organic Chemistry, 1991. 12. 20, Vol. 56/No. 26, p. 7336-7340	11
Y	FILLER, R. et al., Synthesis of fluorovinylsalicylic acids and their derivatives, Journal of Fluorine Chemistry, September 1995, Vol. 74/No. 1, p. 69-75	11
Y	PAN, R. et al., A novel and convenient synthetic method for producing alfa-(trifluoromethyl)styrenes (3), Journal of Fluorine Chemistry, 1999. 06. 04, Vol. 95/No. 1-2, p. 167-170	11

国際調査報告

国際出願番号 PCT/J P 2007/059040

第II欄 請求の範囲の一部の調査ができないときの意見（第1ページの2の続き）

法第8条第3項（PCT17条(2)(a)）の規定により、この国際調査報告は次の理由により請求の範囲の一部について作成しなかった。

1. ☐ 請求の範囲 _____ は、この国際調査機関が調査をすることを要しない対象に係るものである。つまり、
2. ☐ 請求の範囲 _____ は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない国際出願の部分に係るものである。つまり、
3. ☐ 請求の範囲 _____ は、従属請求の範囲であってPCT規則6.4(a)の第2文及び第3文の規定に従って記載されていない。

第III欄 発明の単一性が欠如しているときの意見（第1ページの3の続き）

次に述べるようにこの国際出願に二以上の発明があるところこの国際調査機関は認めた。

請求の範囲1-10に記載の発明に係る化合物と請求の範囲11に記載の発明に係る化合物とは、同一の、又は対応する特別な技術的特徴とみるべき共通の化学構造が存在しない。

したがって、請求の範囲1-10に記載の発明と請求の範囲11に記載の発明とは、発明の単一性の要件を満たさない。

1. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料をすべて期間内に納付したので、この国際調査報告は、すべての調査可能な請求の範囲について作成した。
2. ☒ 追加調査手数料を要求するまでもなく、すべての調査可能な請求の範囲について調査することができたので、追加調査手数料の納付を求めなかった。
3. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を一部のみしか期間内に納付しなかったため、この国際調査報告は、手数料の納付のあった次の請求の範囲のみについて作成した。
4. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を期間内に納付しなかったため、この国際調査報告は、請求の範囲の最初に記載されている発明に係る次の請求の範囲について作成した。

追加調査手数料の異議の申立てに関する注意

- ☐ 追加調査手数料及び、該当する場合には、異議申立手数料の納付と共に、出願人から異議申立てがあった。
- ☐ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがあったが、異議申立手数料が納付命令書に示した期間内に支払われなかった。
- ☐ 追加調査手数料の納付を伴う異議申立てがなかった。